

# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP05/006887

International filing date: 30 March 2005 (30.03.2005)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP  
Number: 2004-374007  
Filing date: 24 December 2004 (24.12.2004)

Date of receipt at the International Bureau: 16 June 2005 (16.06.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland  
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse

日 本 国 特 許 庁  
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日

Date of Application:

2 0 0 4 年 1 2 月 2 4 日

出 願 番 号

Application Number:

特願 2 0 0 4 - 3 7 4 0 0 7

パリ条約による外国への出願  
に用いる優先権の主張の基礎  
となる出願の国コードと出願  
番号

The country code and number  
of your priority application,  
to be used for filing abroad  
under the Paris Convention, is

J P 2 0 0 4 - 3 7 4 0 0 7

出 願 人

Applicant(s):

日本曹達株式会社

2 0 0 5 年 6 月 1 日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小 川



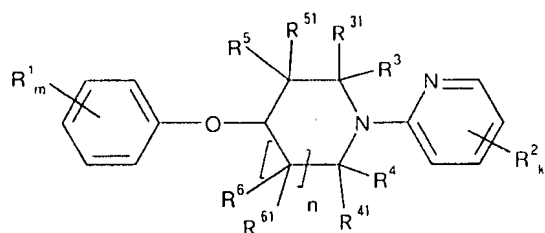
【書類名】 特許願  
【整理番号】 04P000073  
【あて先】 特許庁長官殿  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 浜本 伊佐美  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 高橋 淳  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 矢野 貞樹郎  
【発明者】  
    【住所又は居所】 神奈川県小田原市高田3 4 5 日本曹達株式会社 小田原研究所  
                                内  
    【氏名】 花井 大輔  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000004307  
    【氏名又は名称】 日本曹達株式会社  
【代理人】  
    【識別番号】 100113860  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 松橋 泰典  
【先の出願に基づく優先権主張】  
    【出願番号】 特願2004-106668  
    【出願日】 平成16年 3月31日  
【手数料の表示】  
    【予納台帳番号】 005256  
    【納付金額】 16,000円  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 特許請求の範囲 1  
    【物件名】 明細書 1  
    【物件名】 要約書 1  
    【包括委任状番号】 0303064

【書類名】 特許請求の範囲

【請求項 1】

式【1】

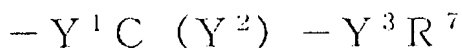
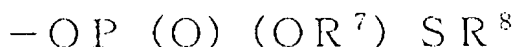
【化1】



【1】

【式中、 $R^1$ は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、 $G^1$ で置換されても良い $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基、 $C_{1-6}$ ハロアルケニル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、 $G^2$ で置換されても良い $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ ハロアルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオカルボニルオキシ基、 $G^3$ で置換されても良いアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルチオ基、 $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニルオキシ基、または下記式

【化2】



( $R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して $C_{1-6}$ アルキル基を表す。 $Y^1$ 、 $Y^2$ 、および $Y^3$ はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を表す。)

で表される置換基のいずれかを表し、 $m$ は0または1～5の整数を表す。

$R^2$ は、ハロゲン原子、ニトロ基、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基、または $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基を表し、 $k$ は0または1～4の整数を表す。

$R^3$ 、 $R^{31}$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{51}$ 、 $R^6$ 、および $R^{61}$ は、それぞれ独立して水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、 $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。

$G^1$ は、ヒドロキシル基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、または $C_{3-6}$ シクロアルキル基を表す。

$G^2$ は、ヒドロキシル基、シアノ基、 $G^4$ で置換されていても良いアミノ基、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、 $C_{3-6}$ シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは $C_{1-6}$ アルキル基で置換されていても良い $C_{6-10}$ アリール基を表す。

$G^3$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、または $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基を表す。

$G^4$ は $C_{1-6}$ アルキル基、または $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基を表す。

$n$ は0または1を表す。]

で表される化合物、式【1】で表される化合物の塩およびN-酸化物。

【請求項 2】

請求項 1 記載の化合物を含有する有害生物防除剤。

【書類名】明細書

【発明の名称】環状アミン化合物および有害生物防除剤

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な環状アミン化合物およびそれらを有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

【背景技術】

【0002】

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題によりその使用が制限されたり、また、植物体に薬害や汚染を生じたり、あるいは人畜魚類などに対する毒性が強かったりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

【0003】

本発明化合物と類似した骨格を有する化合物が、特許文献1に抗ウイルス剤として記載されているが、殺ダニ活性を有する旨は記載されてなく、本発明化合物の合成および生物活性についてはこれまで報告されていなかった。

【特許文献1】欧州特許出願公報第0605031号明細書

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、工業的に有利に合成でき効果が確実で安全に使用できる有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

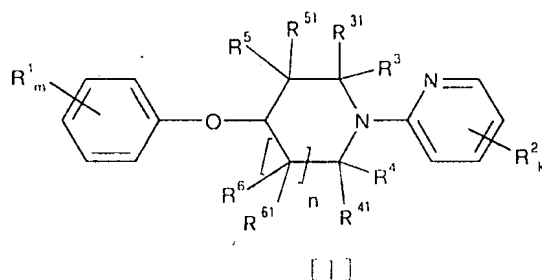
【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、式[1]

【0006】

【化1】

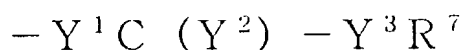
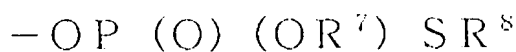


【0007】

【式中、R<sup>1</sup>は、ヒドロキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、G<sup>1</sup>で置換されても良いC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルケニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基、G<sup>2</sup>で置換されても良いC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>ハロアルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオカルボニルオキシ基、G<sup>3</sup>で置換されても良いアミノ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルフィニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニルオキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロアルキルスルホニルオキシ基、または下記式

【0008】

【化2】



【0009】

( $\text{R}^7$ および $\text{R}^8$ はそれぞれ独立して $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を表す。 $\text{Y}^1$ 、 $\text{Y}^2$ 、および $\text{Y}^3$ はそれぞれ独立して酸素原子または硫黄原子を表す。)

で表される置換基のいずれかを表し、 $m$ は0または1～5の整数を表す。

$\text{R}^2$ は、ハロゲン原子、ニトロ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル基、または $\text{C}_{1-6}$ ハロアルコキシ基を表し、 $k$ は0または1～4の整数を表す。

$\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{31}$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^{41}$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{51}$ 、 $\text{R}^6$ 、および $\text{R}^{61}$ は、それぞれ独立して水素原子、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、または $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基を表し、 $\text{R}^3$ と $\text{R}^4$ または $\text{R}^5$ と $\text{R}^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。

$\text{G}^1$ は、ヒドロキシル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、または $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基を表す。

$\text{G}^2$ は、ヒドロキシル基、シアノ基、 $\text{G}^4$ で置換されていても良いアミノ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシカルボニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基、 $\text{C}_{3-6}$ シクロアルキル基、またはハロゲン原子もしくは $\text{C}_{1-6}$ アルキル基で置換されていても良い $\text{C}_{6-10}$ アリール基を表す。

$\text{G}^3$ は、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニル基、または $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基を表す。

$\text{G}^4$ は $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、または $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニル基を表す。

$n$ は0または1を表す。]

で表される化合物、式【1】で表される化合物の塩およびN-酸化物を有効成分として含有してなる有害生物防除剤である。

【発明を実施するための最良の形態】

【0010】

本明細書中において、ハロゲン原子の例としてフッ素、塩素、臭素、ヨウ素等を挙げる事が出来る。

【0011】

$\text{R}^1 \sim \text{R}^8$ 、 $\text{R}^{31}$ 、 $\text{R}^{41}$ 、 $\text{R}^{51}$ 、 $\text{R}^{61}$ の $\text{C}_{1-6}$ アルキル基の例として、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、sec-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ベンチルおよびその異性体、ヘキシルおよびその異性体等を挙げる事が出来る。

【0012】

$\text{R}^1$ の $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基の例としてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル等を挙げる事が出来る。

【0013】

$\text{R}^1$ の $\text{C}_{2-6}$ アルキニル基の例としてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-メチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、2-メチル-3-ペンチニル、1-ヘキシニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル等を挙げる事が出来る。

【0014】

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ の $\text{C}_{1-6}$ ハロアルキル基の例として、クロロメチル、フルオロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、トリクロロメチル、トリ

フルオロメチル、モノブロモジフルオロメチル、トリフルオロエチル、1-クロロエチル、2-クロロエチル、1-ブロモエチル、2-ブロモエチルペンタフルオロエチル等を挙げることが出来る。

【0015】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルケニル基の例として、3-クロロ-2-プロベニル、3,3-ジクロロ-2-プロベニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0016】

$R^1$ 、 $G^3$ 、 $G^4$ の $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基の例として、メチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、ブチルカルボニル等を挙げることが出来る。

【0017】

$R^1 \sim R^8$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{51}$ 、 $R^{61}$ 、 $G^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシ基の例として、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、sec-ブトキシ、イソブトキシ、t-ブトキシ等を挙げることが出来る。

【0018】

$R^1$ 、 $R^{21}$ の $C_{1-6}$ ハロアルコキシ基の例として、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、1,1-ジフルオロエトキシ、フルオロエトキシ、1,1-ジフルオロエトキシ等を挙げることが出来る。

【0019】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基の例として、ビニルオキシ、アリルオキシ、アレニルオキシ、ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0020】

$R^1$ の $C_{2-6}$ ハロアルケニルオキシ基の例として、3-クロロ-2-プロベニルオキシ、3,3-ジクロロ-2-プロベニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルオキシ、4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0021】

$R^1$ の $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基の例として、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ、2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0022】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基の例として、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル等の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基等を挙げることが出来る。

【0023】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基の例として、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ等を挙げることが出来る。

【0024】

$R^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシカルボニルオキシ基の例として、メトキシカルボニルオキシ、エトキシカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0025】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルチオカルボニルオキシ基の例として、メチルチオカルボニルオキシ、エチルチオカルボニルオキシ等を挙げることが出来る。

【0026】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルチオ基の例として、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ等を挙げることが出来る。

【0027】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルチオ基の例として、モノフルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ等を挙げることが出来る。

【0028】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基の例として、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル等を挙げる事が出来る。

【0029】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルフィニル基の例として、トリフルオロメチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニル等を挙げる事が出来る。

【0030】

$R^1$ 、 $G^3$ の $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基の例として、メチルスルホニル、エタンスルホニル等を挙げる事が出来る。

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニル基の例として、トリフルオロメチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニル等を挙げる事が出来る。

【0031】

$R^1$ の $C_{1-6}$ アルキルスルホニルオキシ基の例として、メチルスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ等を挙げる事が出来る。

【0032】

$R^1$ の $C_{1-6}$ ハロアルキルスルホニルオキシ基の例として、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、ペンタフルオロエチルスルホニルオキシ等を挙げる事が出来る。

【0033】

$G^1$ 、 $G^2$ の $C_{1-6}$ アルコキシアルコキシ基の例として、メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、エトキシメトキシ等を挙げる事が出来る。

【0034】

$G^1$ 、 $G^2$ の $C_{3-6}$ シクロアルキル基の例として、シクロプロピル、1-メチルシクロプロピル、2, 2, 3, 3-テトラメチルシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、1-メチルシクロペンチル、シクロヘキシル、1-メチルシクロヘキシル、4-メチルシクロヘキシル等を挙げる事が出来る。

【0035】

$G^2$ の $C_{6-10}$ アリール基の例として、フェニル、ナフチル等を挙げる事が出来る。

【0036】

式[1]中の $m$ は0または1~5の整数を表し、複数個の $R^1$ を有する場合、同一または互いに異なっていて良い。 $k$ は0または1~4の整数を表し、複数個の $R^2$ を有する場合、同一または互いに異なっていて良い。

【0037】

式中の $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成してもよい。 $R^3$ と $R^4$ または $R^5$ と $R^6$ は一緒になって飽和環を形成し、全体として、例えば、8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環(以下トロパン環と称する)、3-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環(以下、イソトロパン環と称する)、3-アザビシクロ[3. 3. 1]ノナン等の橋かけ環を形成してもよい。

【0038】

また、本発明化合物[1]のピリジン環の窒素原子やピペリジン環、トロパン環、イソトロパン環等の環状アミン部の窒素原子が酸化された化合物が存在するが、これらのN-酸化物も全て本発明に含まれる。

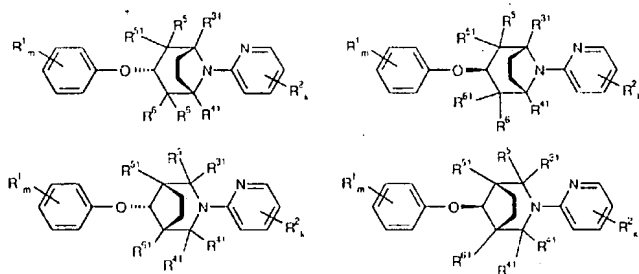
【0039】

本発明化合物[1]の $R^3$ と $R^4$ とが、または $R^5$ と $R^6$ とが一緒になって飽和環を形成する場合、以下の例に示すような2種ずつの異性体が存在する。これらの異性体は全て本発明に含まれる。

【0040】



## 【化3】

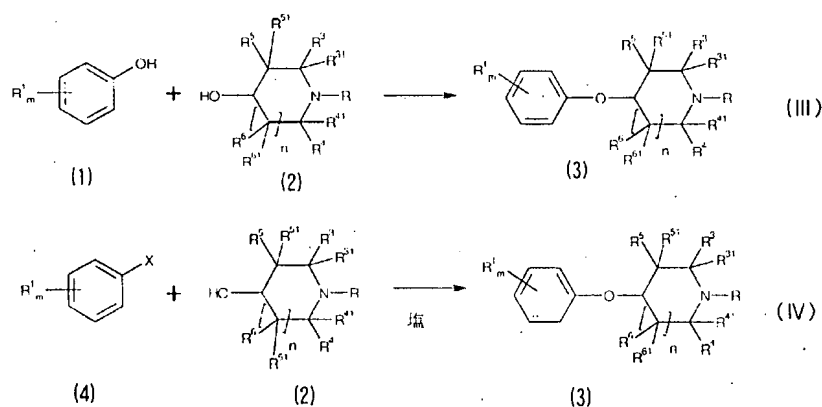


【 0 0 4 1 】

本発明化合物の製造法について、以下説明する。

【 0 0 4 2 】

## 【化 4】



【 0 0 4 3 】

〔式中、 $R^1 \sim R^6$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{51}$ 、 $R^{61}$ 、 $m$ および $n$ は前記と同じ意味を表し、 $X$ は、脱離基を表す。また、 $R$ は、 $R^2_k$ で置換された2-ピリジル基、メチル基、ベンジル基のいずれかを表す。〕

【 0 0 4 4 】

まず、中間体(3)の製造方法について説明する。

反応式(III)に示すとおり、フェノール(1)と化合物(2)との形式的な脱水反応、例えば、光延反応により、中間体(3)を製造することができる。その具体的な方法については、Tetrahedron Lett., 1978, 2243; J. Org. Chem., 50, 3095 (1985)等に記載されている。なお、フェノール(1)の製造法については、"The Chemistry of Phenols," Eds. Z. Rappoport, J. Wiley (2003), Part 1, pp 395 等に記載されている。

【 0 0 4 5 】

また、反応式(IV)に示すとおり、アリールハライド(4)と化合物(2)とのカップリングによっても中間体3を合成することができる。その具体的な方法については、Synth. Commun., 1984, 14, 621; J. Org. Chem., 48, 3771 (1983); J. Med. Chem., 17, 1000 (1974)等に記載されている。

【 0 0 4 6 】

この際、使用できる塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸塩、ナトリウムメトキシド、カリウム、*t*-ブトキシド、マグネシウムエトキシド等の金属アルコキシド、*n*-ブチルリチウム、LiDA等の有機金属、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、トリエ

チルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基等が挙げられる。本反応は溶媒存在下または無溶媒で行うことができる。使用できる溶媒としては、反応に不活性な溶媒であれば特に限定されず、例えばペンタン、ヘキサン、ヘプタン、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素系溶媒、ジクロロメタン、1, 2-ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン系溶媒、アセトニトリル、プロピオンニトリル等のニトリル系溶媒、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒、N, N-ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO) 等の非プロトン性極性溶媒、およびこれらの溶媒を二つ以上混合した混合溶媒系が挙げられる。反応温度は-78℃から用いる溶媒の沸点までの温度範囲から任意の温度で反応させることができる。

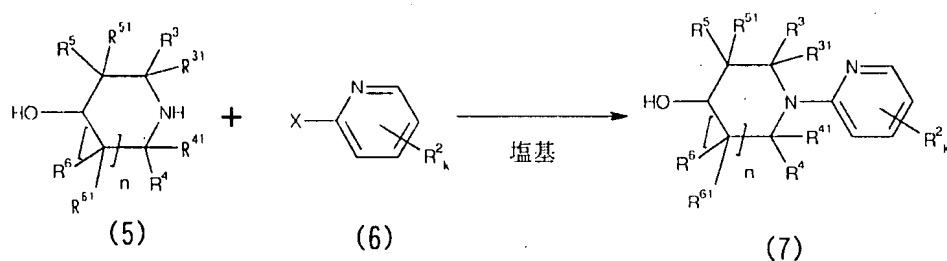
#### 【0047】

化合物(2)において、Rが、R<sub>2</sub>で置換された2-ピリジル基の場合(化合物(7))、反応式(III)または反応式(IV)により、直接的に、本発明化合物[I]を製造できる。

なお、化合物(7)は、反応式(V)に示すとおり、アミン5と2-ハロピリジン6とのカップリングによって合成することができる。その具体的な方法は、*Synthesis*, 1981, 606; *J. Chem. Soc., C*, 3693 (1971)等に記載されている。

#### 【0048】

##### 【化5】



#### 【0049】

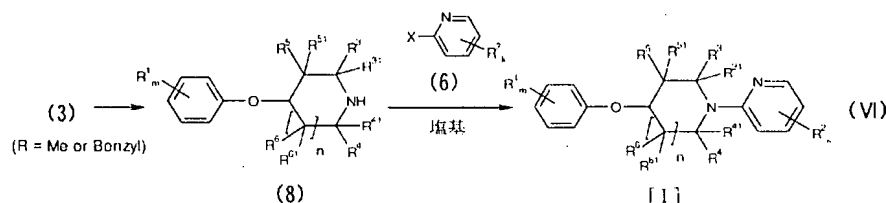
一方、化合物(2)において、Rが、メチル基またはベンジル基の場合は、反応式(III)または反応式(IV)により得られた中間体(3)から、脱メチル化または脱ベンジル化を行う必要がある。

#### 【0050】

脱メチル化の具体的な方法は、*Tetrahedron Lett.*, 1974, 1325; *ibid.*, 1977, 1565; *ibid.*, 1995, 8867等に記載されている。また、脱ベンジル化は、通常、接触水素還元などを用いることができる。こうして、反応式(VI)に示すように、中間体(3)から、中間体(8)を得、次いで、2-ハロピリジン(6)とのカップリングによって、本発明化合物[I]を製造できる。このカップリングの具体的な方法は、反応式(V)と同様である。

#### 【0051】

##### 【化6】



#### 【0052】

なお、化合物(2)(Rが、メチル基またはベンジル基)は、市販品をそのまま使用できる。また、中間体(8)は、アミンとして単独で、または、塩酸や酢酸などと塩を形成して存在してもよい。

#### 【0053】

以上の縮合反応終了後は、生成物の精製が必要であれば、蒸留、再結晶またはカラムクロマトグラフィー等の公知慣用の方法により精製することができる。

#### 【0054】

本発明化合物(式(I))で表される化合物、その塩またはN-酸化物)は農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシנקイガ、ナシヒメシנקイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロッパアンコンボーラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、シルバーリーフコナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

甲虫目害虫、例えば、キスジノミハムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロシヨウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネツタイシマカ、シナハマダラカ等、

アザミウマ目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、トノサマバッタ、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ等

シロアリ目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ、ネコノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレビバルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イネシンガレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

#### 【0055】

適用が好ましい有害生物としては、鱗翅目害虫、半翅目害虫、ダニ類、アザミウマ目害虫、甲虫目害虫であり、特に好ましくは、ダニ類である。

#### 【0056】

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤、ピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や、殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

#### 【0057】

また本発明化合物は薬害が少なく、魚類や温血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することもできる。

#### 【0058】

本発明化合物の中には、殺菌活性、除草活性、植調作用を示すものもある。また本発明化合物の中間体化合物の中には殺虫・殺ダニ活性を示すものもある。

#### 【0059】

本発明殺虫・殺ダニ剤は本発明化合物の1種又は2種以上を有効成分として含有する。本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えずそのまま使用できるが、通常は、さらに固体担体、液体担体、ガス状担体と混合し、または多孔セラミック板や不織布等の基剤に含浸し、必要により界面活性剤、その他の補助剤を添加して、農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、顆粒水和剤、フロアブル、エアゾール、煙霧剤、加熱蒸散剤、燻煙剤、毒餌、マイクロカプセル等の形態に製剤化して使用する。

#### 【0060】

添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燐灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キシレンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用することができる。噴射剤に用いられるガス状担体としては、ブタンガス、LPG、ジメチルエーテルおよび炭酸ガスを使用することができる。

#### 【0061】

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドロゲアイアレチック酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料等の害虫誘引性香料を使用することができる。

#### 【0062】

これらの製剤において均一かつ安定な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。界面活性剤としては、特に限定はないが、例えば、ポリオキシエチレンが付加したアルキルエーテル、ポリオキシエチレンが付加した高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したソルビタン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンが付加したトリスチリルフェニルエーテル等の非イオン性界面活性剤、ポリオキシエチレンが付加したアルキルフェニルエーテルの硫酸エステル塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ポリカルボン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルムアルデヒド縮合物、イソブチレン-無水マレイン酸の共重合体等が挙げられる。

#### 【0063】

本発明化合物を農業用の有害性物防除剤として使用する場合、その製剤中の有効成分量は0.01~90重量%であり、とくに好ましくは0.05~85重量%であり、水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤、顆粒水和剤は水で所定の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま植物或いは土壌に散布する方法で使用される。

#### 【0064】

また、本発明化合物を防疫用の有害性物防除剤として使用する場合には、乳剤、水和剤、フロアブル剤等は水で所定の濃度に希釈して施用し、油剤、エアゾール、煙霧剤、毒餌、防ダニシート等についてはそのまま施用する。

#### 【0065】

本発明化合物をウシ、ブタ等の家畜類、イヌ、ネコ等のペット類の動物外部寄生虫防除

用の有害生物防除剤として使用する場合は、通常本発明化合物の製剤を、獣医学的に公知の方法で使用する。その方法としては、例えば全身的抑制（systemic control）を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）等により投与する方法が挙げられ、非全身的（non-systemic control）を目的とする場合は、油性又は水性液剤を噴霧、注ぎかけ（pour-on）、滴下（spot-on）等により投与する方法および樹脂製剤を首輪、耳札等の適当な形状に成形した物を装着する方法が挙げられる。この場合、通常宿主動物1kgに対して、本発明化合物として0.01-1000mgの割合で使用される。

#### 【0066】

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、他の有害生物防除剤、殺菌剤、殺虫・殺ダニ剤、除草剤、植物調節剤、共力剤、肥料、土壌改良剤、動物用飼料等の1種又は2種以上と混用または併用することもできる。

#### 【0067】

本発明化合物と混用または併用することのできる殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤等の有効成分の代表例を以下に示す。

#### 【0068】

##### 殺菌剤：

キャブタン、フォルベット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニン、キントーゼン、キャブタホル、イブロジオン、プロサイミドン、ピンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ベンシクロン、オキシカルボキシ、ホセチルアルミニウム、プロバモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ピテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルジラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ベフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロビモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシ、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、ブラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルベンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ピナバクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メバニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、トリシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロバモカルブ塩酸塩、オキシリニックス酸。

#### 【0069】

##### 殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロロホン、チオメトン、ホスメット、ジクロロボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、ホサロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロバホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフェ

ンカルブ、フェノキシカルブ、カルタップ、チオシクラム、ペンスルタップ等。

【0070】

ピレスロイド系殺虫剤：

ベルメトリン、シベルメトリン、デルタメスリン、フェンバレーレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロバスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロックス、シクロプロトリン、トラロメトリン、シラフルオフェン、アクリナトリン等。

【0071】

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトブレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、イミダクロプリド、フィプロニル、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

【0072】

殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、BPPS、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、CPCBS、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

【0073】

植物生長調節剤：

ジベレリン類（例えばジベレリンA3、ジベレリンA4、ジベレリンA7）IAA、NAA。

【実施例】

【0074】

次に、実施例を挙げて、本発明をさらに詳細に説明する。実施例中の化合物番号の記載は表1～9のいずれかに記載の番号を示す。

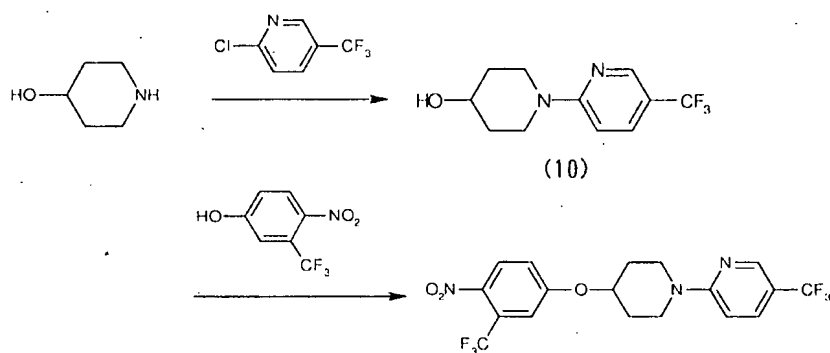
【0075】

製造例1

4-[4-Nitro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidineの製造（化合物番号1-39）

【0076】

【化7】



【0077】

4-ヒドロキシピペリジン (3.0 g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (5.4 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、トリエチルアミン (4.5 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を水に注いで、クロロホルムで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、化合物 (10) (5.98 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

【0078】

化合物 (10) (4.9 g)、5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾトリフルオリド (3.2 g)、およびトリフェニルホスフィン (5.6 g) の THF (30 ml) 溶液に、氷冷下、アゾジカルボン酸ジイソプロピルエステル (4.3 g) の THF (30 ml) 溶液を滴下した。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (5.98 g) を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.86–1.97 (m, 2H), 2.04–2.14 (m, 2H), 3.64–3.72 (m, 2H), 3.90–3.99 (m, 2H), 4.71–4.77 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

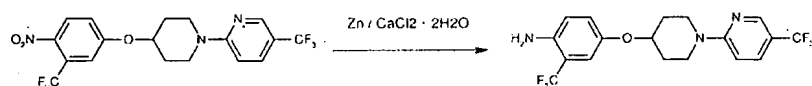
【0079】

製造例 2

4-[4-Amino-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-168)

【0080】

【化8】



【0081】

製造例 1 で得られたピペリジン (化合物番号 1-39, 5.7 g) のエタノール (300 ml) 溶液に、亜鉛末 (18.8 g)、塩化カルシウム 2 水和物 (1.9 g) を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をクロロホルムで希釈、水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (5.4 g) を得た。

$n_D^{20}$  1.5259

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.77–1.88 (m, 2H), 1.94–2.04 (m, 2H), 3.53–3.61 (m, 2H), 3.90–3.99 (m, 3~4H), 4.38–4.45 (m, 1H), 6.69 (t, 2H), 7.00 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

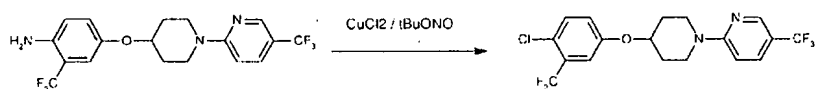
【0082】

製造例 3

4-[4-Chloro-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-15)

【0083】

【化 9】



【0084】

塩化銅(II) (0.14 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、水冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.13 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、水冷下、製造例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1-168, 0.35 g) のアセトニトリル (3 ml) 溶液を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 1 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.2 g) を得た。

$n_D^{21.9} 1.5275$

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.82–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.89–3.97 (m, 2H), 4.56–4.63 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

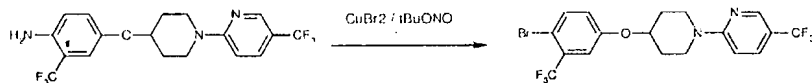
【0085】

製造例 4

4-[4-Bromo-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-piperidine の製造 (化合物番号 1-23)

【0086】

【化 10】



【0087】

臭化銅(II) (0.22 g) のアセトニトリル (5 ml) 懸濁液に、水冷下、亜硝酸 t-ブチル (0.12 g) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後に、水冷下、製造例 2 で得られたピペリジン (化合物番号 1-168, 0.32 g) のアセトニトリル (2 ml) を加えた。混合物を室温に昇温してさらに 2.5 時間攪拌した。混合物を氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.21 g) を得た。

$n_D^{21.9} 1.5365$

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.81–1.92 (m, 2H), 1.99–2.08 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.88–3.96 (m, 2H), 4.57–4.63 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0088】

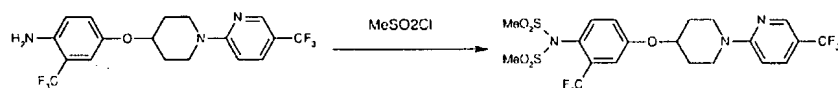
製造例 5

4-[4-[Bis(methylsulfonyl)amino]-3-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-178)

【0089】



【化11】



【0090】

製造例2で得られたピペリジン(化合物番号1-168、0.32g)のTHF(5ml)溶液に、氷冷下、メタンスルホニルクロリド(0.09g)とトリエチルアミン(0.08g)を加えた。混合物を室温に昇温して4時間攪拌し、さらに3.5時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.20g)を得た。

amorphous

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.87–1.96 (m, 2H), 2.01–2.10 (m, 2H), 3.47 (s, 6H), 3.64–3.73 (m, 2H), 3.88–3.96 (m, 2H), 4.64–4.69 (m, 1H), 6.70 (d, 1H), 7.13 (dd, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

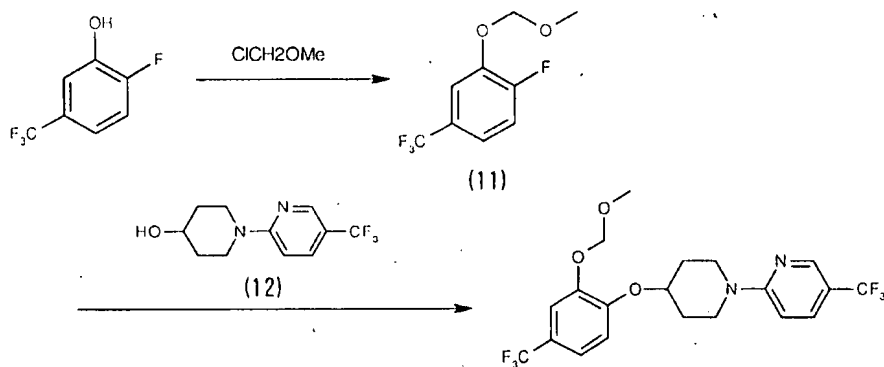
【0091】

製造例6

4-[2-(Methoxymethoxy)-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造(化合物番号1-105)

【0092】

【化12】



【0093】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(0.36g)のDMF(5ml)溶液に、60%水素化ナトリウム(88mg)を加えて、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル(0.24g)を滴下し、混合物を室温に昇温して5時間攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、粗製の化合物(11)(0.45g)を得て、このまま次の反応に用いた。

【0094】

ピペリジノール(12)(0.49g)のDMF(5ml)溶液に、室温で、60%水素化ナトリウム(90mg)を加えた。混合物を10分間攪拌した後に、ベンゾトリフルオリド(11)のDMF(5ml)溶液を加えて、約100℃まで昇温して、一晚攪拌した。混合物を混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラム

クロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.56 g) を得た。

$n_D^{23.9}$  1.4969

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.87–1.96 (m, 2H), 2.00–2.08 (m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.56–3.65 (m, 2H), 3.95–4.03 (m, 2H), 4.61–4.65 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 6.69 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

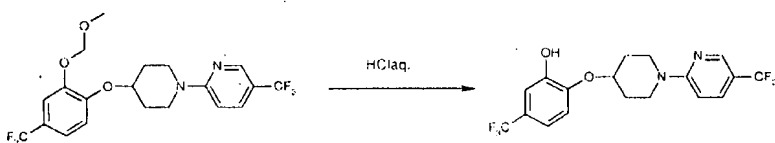
【0095】

製造例 7

4-[2-Hydroxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-4)

【0096】

【化13】



【0097】

製造例 6 で得られたピペリジン (化合物番号 1-105, 0.38 g) の THF (5 ml) 溶液に、室温で 10% 塩酸水 (5 ml) を加えた。混合物を 2 時間攪拌した後、10% 塩酸水 (5 ml) を加えて、一晩攪拌した。混合物を水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和重曹水、食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物 (0.31 g) を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.85–1.94 (m, 2H), 2.11–2.17 (m, 2H), 3.48–3.57 (m, 2H), 4.02–4.10 (m, 2H), 4.66–4.70 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.70 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

【0098】

製造例 8

4-[2-Acetoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造 (化合物番号 1-167)

【0099】

【化14】



【0100】

製造例 7 で得られたピペリジン (化合物番号 1-105, 0.17 g) とトリエチルアミン (50 mg) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に、氷冷下、塩化アセチル (36 mg

)を加えた。混合物を室温に昇温して3時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、標記化合物(0.22g)を得た。

mp. 85-95℃

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.88-2.05 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 3.70-3.84 (m, 4H), 4.68-4.70 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

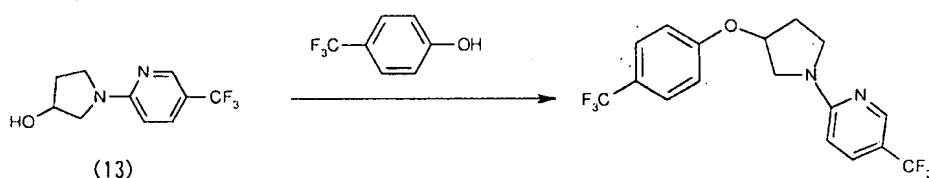
【0101】

#### 製造例9

3-[4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]pyrrolidineの製造(化合物番号8-63)

【0102】

【化15】



【0103】

ピロリジノール(13)(0.35g)と4-トリフルオロメチルフェノール(0.16g)を用いて、実施例1と同様の方法により、標記化合物(0.32g)を得た。なお、化合物(13)は、製造例1の化合物(10)と同様の方法により調整した。

mp. 109-112℃.

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 2.26-2.46 (m, 2H), 3.62-3.75 (m, 2H), 3.85 (s, 2H), 5.10-5.15 (m, 1H), 6.42 (d, 1H), 6.96 (d, 2H), 7.56 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0104】

#### 製造例10

2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造(化合物番号1-93)

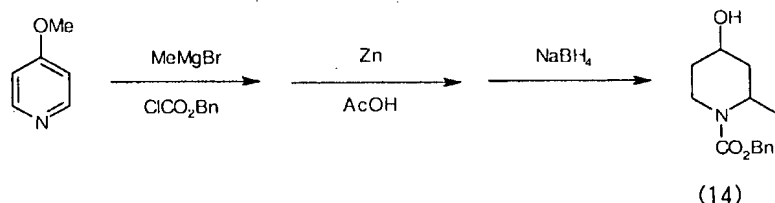
【0105】

#### 工程1

1-Benzylloxycarbonyl-2-methyl-4-piperidinol(14)の製造

【0106】

【化16】



【0107】

以下の反応は、Tetrahedron Lett. 1986, 27, 4549に記載された方法に従った。

4-メトキシピリジン (2.50 g) の THF (25 ml) 溶液に、 $-30^{\circ}\text{C}$  から  $-20^{\circ}\text{C}$  に保ちながら、メチルマグネシウムブロミド (3.0 M エーテル溶液、7.6 ml) を滴下した。混合物を 10 分間攪拌した後、 $-30^{\circ}\text{C}$  から  $-20^{\circ}\text{C}$  に保ち、クロロギ酸ベンジル (3.90 g) を滴下した。混合物を 30 分間攪拌した後、室温まで昇温した。混合物を 10% 塩酸に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して油状物 (5.34 g) を得て、このまま次の反応に用いた。

#### 【0108】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2001, 66, 2181に記載された方法に従った。

この油状物を酢酸 (150 ml) に溶解し、室温で亜鉛 (21.4 g) を加えた。懸濁液を 6 時間加熱還流した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去した。残渣に水を加え、水酸化ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状物 (5.01 g) を得た。この油状物 (2.47 g) のエタノール (25 ml) 溶液に、室温で水素化ホウ素ナトリウム (0.38 g) を加え、混合物を 1 時間攪拌した。混合物を減圧濃縮し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の化合物 (14) (2.39 g) を得た。

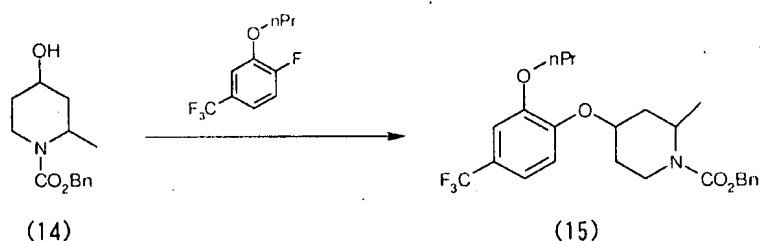
$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.16–1.93 (m, 7H), 2.95–3.37 (m, 1H), 3.88–4.70 (m, 3H), 5.13 (m, 2H), 7.35 (m, 5H)

#### 工程 2

1-Benzylloxycarbonyl-2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]piperidine の製造

#### 【0109】

##### 【化17】



#### 【0110】

化合物 (14) の DMF (25 ml) に、室温で、60% 水素化ナトリウム (0.42 g) を加えた。混合物を 30 分間攪拌した後、4-フルオロ-3-プロポキシベンゾトリフルオライド (2.13 g) を加え、 $100^{\circ}\text{C}$  に昇温して一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物 (15) (1.02 g) を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.05 (t, 3H), 1.26 (m, 3H), 1.50–2.04 (m, 6H), 3.00–3.40 (m, 1H), 3.92–4.16 (m, 3H), 4.50–4.73 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 6.93 (m, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.33 (m, 5H)

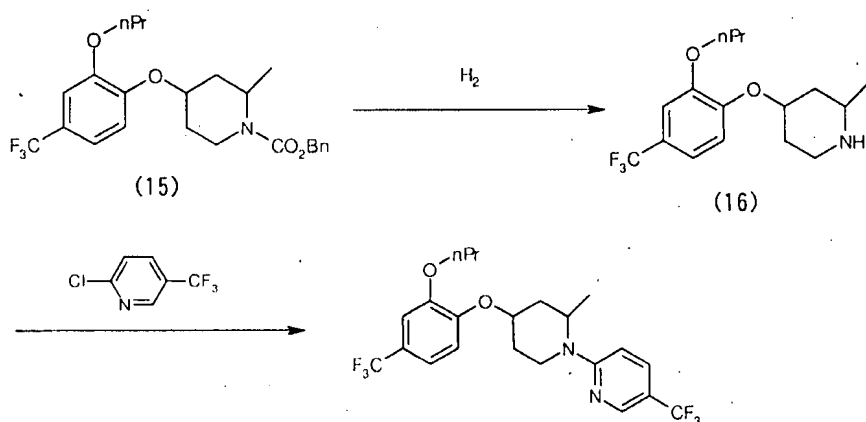
#### 【0111】

### 工程 3

2-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造

【0112】

【化18】



【0113】

化合物(15)のエタノール(25ml)溶液に、5%パラジウム-炭素(0.20g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、80℃で8時間加熱した。混合物を冷却後、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(16)(0.70g)を得た。

このピペリジンのアセトニトリル(15ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(4.0g)と炭酸カリウム(1.53g)を加え、混合物を3日間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(30mg)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.04 (t, 3H), 1.23 (d, 3H), 1.71-1.97 (m, 4H), 2.10-2.26 (m, 2H), 3.05 (m, 1H), 3.98 (t, 2H), 4.43 (m, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.88 (m, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.00-7.26 (m, 3H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0114】

製造例 11

3α-[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造 (化合物番号 2-77)

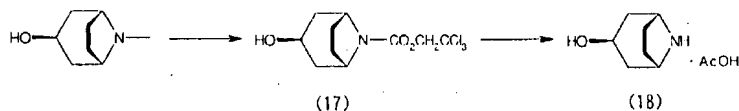
【0115】

工程 1

3α-hydroxy-8-azabicyclo[3.2.1]octane, acetic acid salt (18) の製造

【0116】

【化19】



【0117】

トロピン (14.1 g)、炭酸カリウム (1.4 g) のベンゼン (150 ml) 懸濁液に、クロロギ酸 2, 2, 2-トリクロロエチルエステル (23.3 g) を室温で加え、混合物を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、油状のカーボネート (17) を得て (30.08 g)、そのまま次の反応に用いた。このカーボネート (17) の酢酸 (250 ml) 溶液に、亜鉛末 (65 g) を加えた。混合物を 5 分間攪拌した後に、80℃で 1 時間加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の化合物 (18) を得た (15.5 g)。

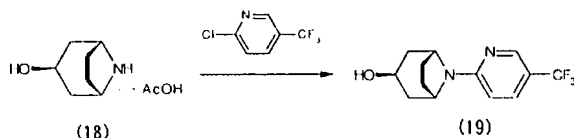
【0118】

工程 2

3α-hydroxy-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane (19) の製造

【0119】

【化20】



【0120】

粗製の化合物 (5.64 g)、炭酸カリウム (41.5 g) および 2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン (8.2 g) のアセトニトリル (150 ml) 懸濁液を 3.5 時間加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶として化合物 (19) を得た (3.5 g)。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.42 (d, 1H), 1.77 (d, 2H), 2.05-2.20 (m, 4H), 2.32-2.39 (m, 2H), 4.09 (brs, 1H), 4.53 (brs, 2H), 6.52 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.38 (d, 1H)

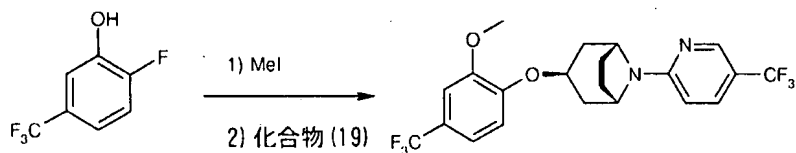
【0121】

工程 3

3α-[2-Methoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造

【0122】

【化21】



【0123】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (0.17 g) の DMF (3 ml) 溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム (35 mg) を加えた。混合物を20分間攪拌した後、ヨードメタン (0.11 g) を加えて、60℃に昇温して40分間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、化合物 (19) (0.22 g) と60%水素化ナトリウム (35 mg) を室温で加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (0.18 g) を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 2.00–2.22 (m, 6H), 2.38–2.44 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.56–4.61 (m, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (br d, 1H)

【0124】

製造例12

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造 (化合物番号2-82)

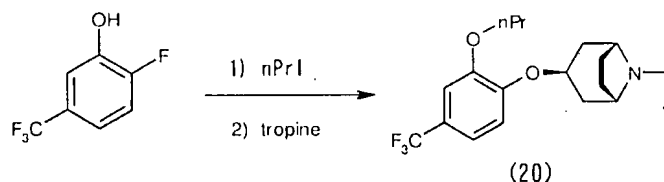
【0125】

工程1

8-Methyl-3α-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octane (20) の製造

【0126】

【化22】



【0127】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.8 g) の DMF (15 ml) 溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム (0.44 g) を加えた。混合物を20分間攪拌した後、1-ヨードプロパン (1.7 g) の DMF (3 ml) 溶液を加えて、さらに4時間攪拌した。混合物にトロピン (1.42 g) と60%水素化ナトリウム (0.43 g) を室温で加え、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の化合物 (20) (1.1 g) を得た。

$^1\text{H}$  NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.08 (t, 3H), 1.83 (q, 2H), 1.90–2.20 (m, 8H), 2.30 (s, 3H), 3.10–3.11 (m, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.58 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.05 (s, 1H), 7.13 (d, 1H)

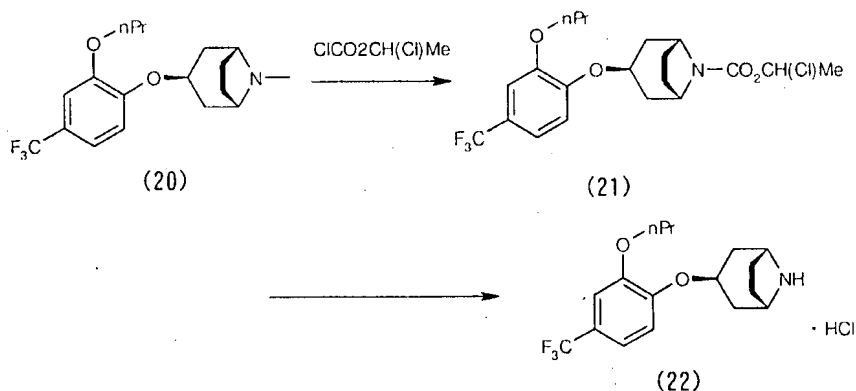
【0128】

工程2

3 $\alpha$ -[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octane, hydrochloric acid salt (22) の製造

【0129】

【化23】



【0130】

化合物(20) (1.0 g) の塩化メチレン (6 ml) 溶液に、室温で、クロロギ酸1-クロロエチルエステル (0.83 g) の塩化メチレン (4 ml) 溶液を加えて、混合物を一晩加熱還流した。混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和重曹水、食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製のカーバネート(21)を得て、このまま次の反応に用いた。

【0131】

化合物(21) にメタノール (6 ml) を加えて、2.5 時間加熱還流した。混合物を減圧濃縮して、粗製の(22)を得て、このまま次の反応に用いた。

$^1\text{H}$  NMR of the salt-free (22) (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.10 (t, 3H), 1.61 (brs, 1H), 1.70–1.92 (m, 4H), 2.01–2.09 (m, 4H), 2.20–2.31 (m, 2H), 3.52 (brs, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.63–4.65 (m, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.15 (d, 1H)

【0132】

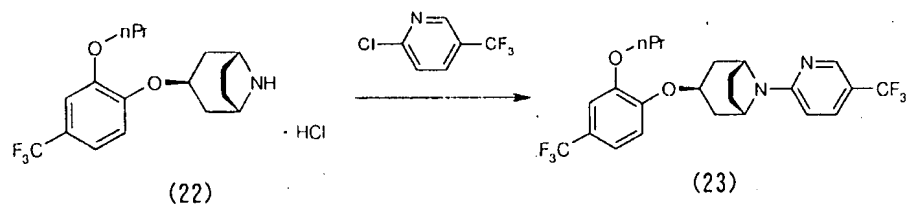
工程3

3 $\alpha$ -[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octane の製造

【0133】



【化24】



【0134】

粗製の(22)、トリエチルアミン(1.18g)、および2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(0.53g)のエタノール(10ml)溶液を一晩加熱還流した。混合物に、トリエチルアミン(3g)、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン(1.6g)およびエタノール(10ml)を加えて、さらに、一晩加熱還流した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.31g)を得た。

mp. 90-92℃

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.09 (t, 3H), 1.82-1.93 (m, 2H), 2.01-2.23 (m, 6H), 2.43-2.50 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.56-4.62 (m, 3H), 6.55 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0135】

製造例13

8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号5-97)

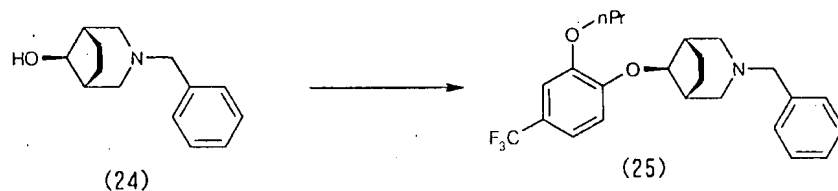
【0136】

工程1

N-Benzyl-8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-azabicyclo[3.2.1]octane (24)の製造

【0137】

【化25】



【0138】

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.2.1]octane-8β-ol (24)は、J. Med. Chem. 2003, 46, 1456-1464に記載された方法で合成した。

【0139】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(0.50g)のDMF(4ml)溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム(0.12g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、1-ヨードプロパン(0.51g)を加えた。混合物を90℃に昇温

して30分間攪拌した。混合物に(24)(0.41g)のDMF(4ml)溶液と60%水素化ナトリウム(0.09g)を室温に加え、15分間攪拌した後、100℃に昇温して2時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、油状の(25)(0.75g)を得た。

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.05 (t, 3H), 1.75–1.91 (m, 6H), 2.19 (d, 2H), 2.34 (br s, 2H), 2.74 (d, 2H), 3.51 (s, 2H), 3.96 (t, 2H), 4.33 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.20–7.34 (m, 5H),

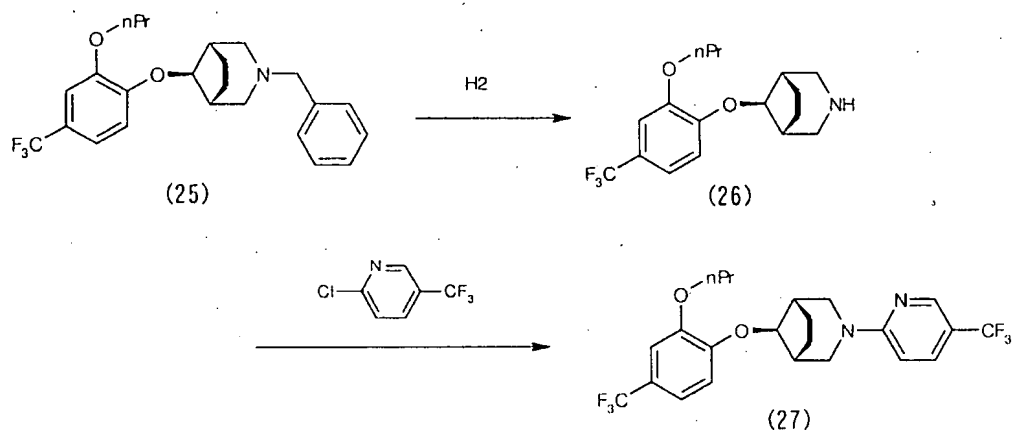
【0140】

工程2

8β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造

【0141】

【化26】



【0142】

化合物(25)(0.66g)のエタノール(20ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(0.13g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で一晩攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の化合物(26)(0.55g)を得た。

【0143】

粗製の化合物(26)(0.55g)のアセトニトリル(12ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(0.57g)と炭酸カリウム(0.66g)を加え、混合物を22時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.26g)を得た。

mp. 48–50℃

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.06 (t, 3H), 1.57–1.63 (m, 2H), 1.85 (sext, 2H), 2.03–2.06 (m, 2H), 2.57 (br s, 2H), 3.08 (d, 2H), 3.98 (t, 2H), 4.15 (d, 2H), 4.63 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0144】

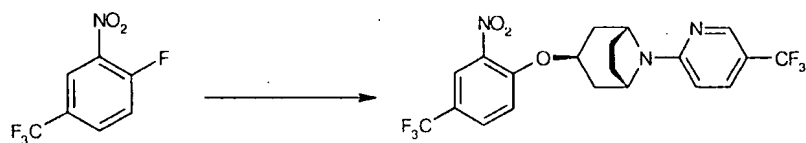
製造例14

3α-[2-Nitro-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-

8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-35)

【0145】

【化27】



(19)

【0146】

製造例11、工程2で得られた化合物(19)(5g)のDMF(50ml)溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム(0.81g)を加えた。混合物を室温で30分間攪拌した後、4-フルオロ-3-ニトロベンゾトリフルオリド(3.84g)を加えた。混合物を室温で1時間攪拌した後、100℃に昇温して一晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、氷水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(4.95g)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 2.01-2.36(m, 8H), 4.59(brs, 2H), 4.75(t, 1H), 6.58(d, 1H), 7.01(d, 1H), 7.63(d, 1H), 7.76(d, 1H), 8.12(s, 1H), 8.40(s, 1H)

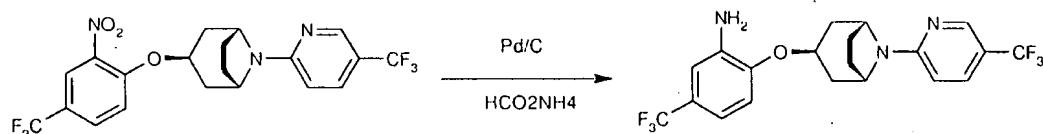
【0147】

実施例15

3α-[2-Amino-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-158)

【0148】

【化28】



【0149】

実施例14で得られた化合物番号2-35(2.14g)のメタノール(24ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(0.21g)とギ酸アンモニウム(1.43g)を加えた。混合物を室温で1時間攪拌した。混合物をセライトを通してろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(1.86g)を得た。

mp. 87-91℃

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 2.03-2.30(m, 8H), 3.95(s, 2H), 4.59-4.64(m, 3H), 6.56(d, 1H), 6.62(d, 1H), 6.94(s, 1H), 6.96(s, 1H), 7.62(d, 1H), 8.41(s, 1H)

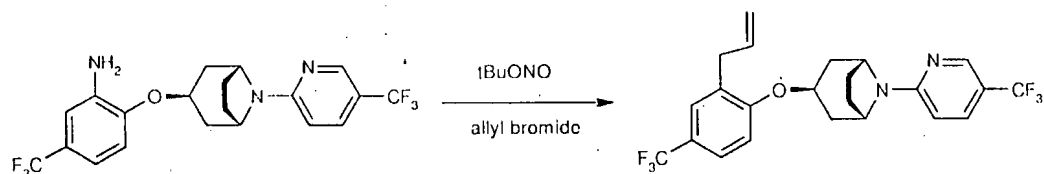
【0150】

製造例16

3 $\alpha$ -[2-Allyl-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-62)

【0151】

【化29】



【0152】

以下の反応は、J. Org. Chem., 2002, 67, 6376-6381に記載された方法に従った。

窒素雰囲気下、亜硝酸t-ブチル(0.18g)、臭化アリル(2.1g)のアセトニトリル(7.5ml)溶液に、室温で、実施例15で得られた化合物番号2-158(0.5g)を少量ずつ加えた。混合物を室温で3時間攪拌した後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(76mg)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.99-2.33 (m, 8H), 3.46 (d, 2H), 4.58 (brs, 3H), 5.08-5.15 (m, 2H), 5.94-6.07 (m, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.69 (d, 1H), 7.42 (brs, 2H)

7.62 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

【0153】

実施例17

9 $\beta$ -[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-100)

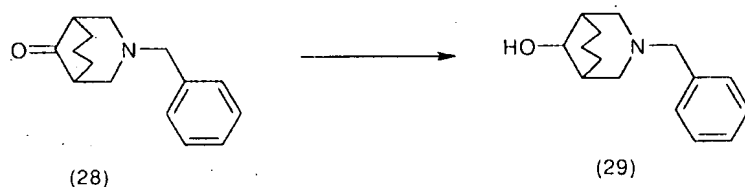
【0154】

工程1

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonan-9-ol(化合物21)の製造

【0155】

【化30】



【0156】

N-Benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonan-9-one(28)は、J. Med. Chem. 1994, 37, 2831-2840に記載され

た方法で合成した。(28)(6.75g)のMeOH(80ml)溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム(1.49g)を加えた。混合物を氷冷下1時間攪拌した後、溶媒を減圧留去した。残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の(29)(6.52g)を得た。

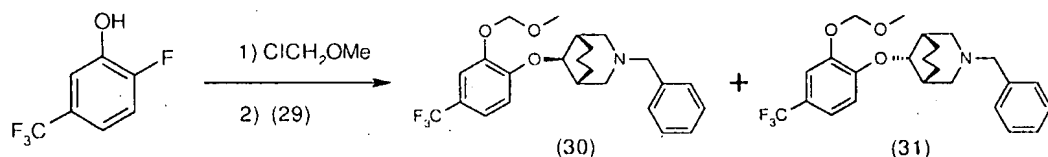
【0157】

## 工程2

9-[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-benzyl-3-azabicyclo[3.3.1]nonane(29)、(30)の製造

【0158】

【化31】



【0159】

4-フルオロ-3-ヒドロキシベンゾトリフルオリド(7.49g)のDMF(75ml)溶液に、氷冷下、60%水素化ナトリウム(1.77g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、氷冷下、クロロメチルメチルエーテル(3.57g)を滴下した。混合物を室温に昇温して30分間攪拌し、さらに80℃に昇温して30分間攪拌した。混合物に化合物(29)(6.4g)と60%水素化ナトリウム(1.33g)を室温で加え、30分間攪拌した後、100℃に昇温して3時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、化合物(30)(6.3g)と化合物(31)(4.25g)を得た。

(0.56g)を得た。

化合物(30): viscous oil

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.43-1.60(m, 3H), 2.01-2.08(m, 4H), 2.36(d, 2H), 2.65-2.80(m, 1H), 3.02(d, 2H), 3.42(s, 2H), 3.53(s, 3H), 4.35(brs, 1H), 5.23(s, 2H), 6.93(d, 1H), 7.21-7.33(m, 8H)

化合物(31): viscous oil.

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.46-1.55(m, 1H), 1.68-1.80(m, 2H), 1.91-1.97(m, 2H), 2.09(brd, 3H), 2.68-2.82(s plus m, 5H), 3.41(s, 2H), 3.54(s, 3H), 4.31(t, 1H), 5.22(s, 2H), 6.92(d, 1H), 7.20-7.33(m, 8H)

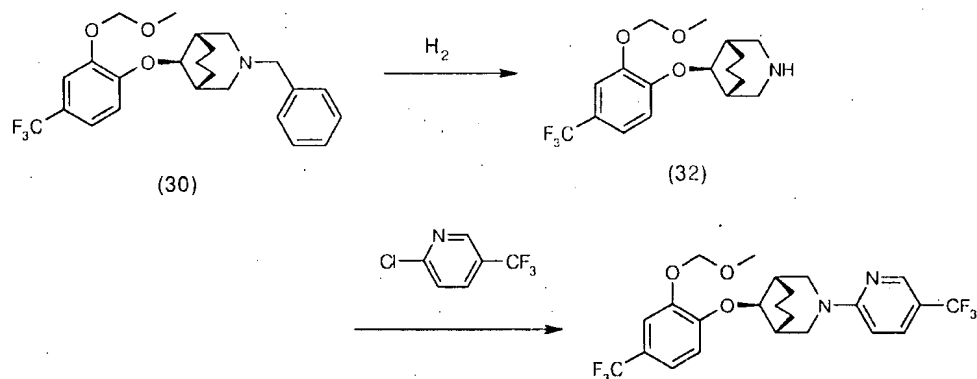
【0160】

## 工程3

9 $\beta$ -[2-Methoxymethoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造

【0161】

【化32】



【0162】

化合物(30)(6.11g)のエタノール(180ml)溶液に、10%パラジウム-炭素(1.22g)を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、室温で1時間、さらに80℃に昇温して7時間攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過し、ろ液を減圧留去して、粗製の(32)(4.54g)を得た。

【0163】

粗製の化合物(32)(4.54g)のアセトニトリル(180ml)溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン(11.92g)と炭酸カリウム(10.9g)を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(2.61g)を得た。

viscous oil

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.44-1.69(m, 3H), 1.74-1.91(m, 1H), 2.08-2.21(m, 2H), 2.32(b r s, 2H), 3.28(d, 2H), 3.54(s, 3H), 4.47(d, 2H), 4.62(t, 1H), 5.25(s, 2H), 6.66(d, 1H), 7.02(d, 1H), 7.25(d, 1H), 7.37(s, 1H), 7.63(dd, 1H), 8.42(s, 1H)

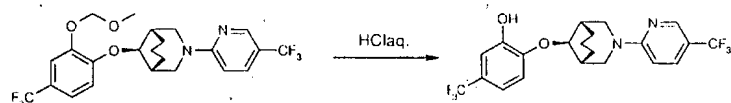
【0164】

実施例18

9β-[2-Hydroxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-4)

【0165】

【化33】



【0166】

製造例17で得られた(化合物番号7-100)(2.54g)を用いて、実施例7と同様の方法により、標記化合物(2.12g)を得た

mp. 108-110℃

$^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.46-1.54(m, 1H), 1.71-1.78(m, 2H), 1.82-1.93(m, 1H), 1.98-2.07(m, 2H), 2.37(b r s, 2H), 3.31(d, 2H), 4.51(d, 2H), 4.70(t,

1H),  
5.81 (s, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.15–7.29 (m, 1H), 7.65 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H)

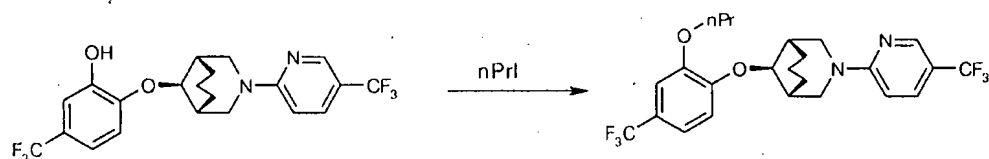
【0167】

製造例19

9β-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-3-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-3-azabicyclo[3.3.1]nonaneの製造(化合物番号7-82)

【0168】

【化34】



【0169】

実施例18で得られた(化合物番号7-4)(0.3g)のDMF(15ml)溶液に、水冷下、60%水素化ナトリウム(0.03g)を加えた。混合物を室温下30分間攪拌した後、水冷下、1-ヨードプロパン(0.13g)を加えて、室温下30分間攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.27g)を得た。

viscous oil

<sup>1</sup>H NMR(CDC13) δ 1.09 (t, 3H), 1.45–1.49 (m, 3H), 1.55–1.93 (m, 3H), 2.16–2.30 (m, 4H), 3.25 (d, 2H), 4.00 (t, 2H), 4.45 (d, 2H), 4.61 (s, 1H), 6.65 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.12–7.24 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H).

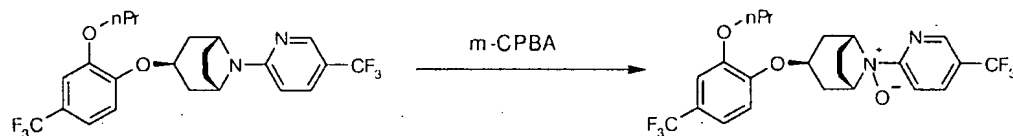
【0170】

実施例20

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-oxy-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-84)

【0171】

【化35】



【0172】

実施例12で得られた(化合物番号2-82)(0.48g)の塩化メチレン(5ml)溶液に、メタクロロ過安息香酸混合物(純度65%、0.28g)を室温で加えた。2時間加熱還流した後、混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液および飽和食塩水で1回ずつ洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(

0.28 g)を得た。

mp. 129–130°C

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.09 (t, 3H), 1.82–1.94 (m, 2H), 2.20–2.41 (m, 8H), 3.77 (brs, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.54 (t, 1H), 6.81 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 8.48 (s, 1H)

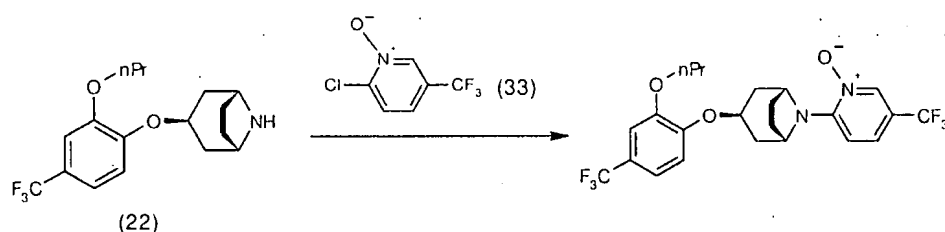
【0173】

実施例 21

3α-[2-Propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-8-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl-1-oxy]-8-azabicyclo[3.2.1]octaneの製造(化合物番号2-83)

【0174】

【化36】



【0175】

ピリジンN-オキシド(33)は、J. Heterocycl. Chem. 1976, 13, 41–42に記載された方法で合成した。実施例13で得られた(22)(0.65 g)のアセトニトリル(6 ml)懸濁液に、ピリジンN-オキシド(33)(0.395 g)と炭酸カリウム(0.82 g)を加え、混合物を8時間加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮し、標記化合物(0.88 g)を得た。

mp. 143–145°C

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.08 (t, 3H), 1.83–1.90 (m, 2H), 2.04–2.15 (m, 4H), 2.25–2.31 (m, 2H), 2.44–2.48 (m, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.68 (brs, 1H), 5.02 (brs, 2H), 6.79–6.84 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.23–7.33 (m, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0176】

実施例 22

cis-3-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidineの製造(化合物番号1-97)

【0177】

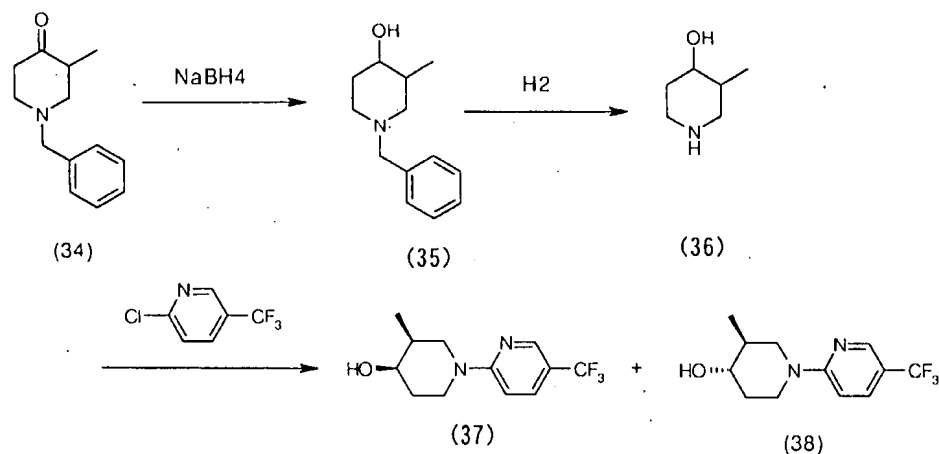
工程 1

cis-3-methyl-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-4-piperidinol(35)およびtrans-3-methyl-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]-4-piperidinol(36)の製造

【0178】



【化 3 7】



【0179】

N-Benzyl-3-methyl-4-piperidone (34) は、文献既知化合物 (CAS. no. [34737-89-8]) で、市販品もある。化合物 (34) (2.53 g) の EtOH (40 ml) 溶液に、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム (0.47 g) を加えた。混合物を室温下 2 時間攪拌した後、氷冷下、10% 塩酸で中和した。混合物を塩化メチレンで抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して、粗製の (35) (2.27 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

【0180】

粗製の (35) (1.82 g) のメタノール (30 ml) 溶液に、20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.2 g) を加えた。この懸濁液を水素雰囲気下、70℃ に昇温して 1 昼夜攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液に 20% 水酸化パラジウム-炭素 (0.9 g) を加え、70℃ に昇温して 1 晩攪拌した。混合物を室温まで冷やした後に、セライトを通してろ過した。ろ液を減圧留去して、粗製の (36) (1.22 g) を得て、そのまま次の反応に用いた。

【0181】

粗製の化合物 (36) (1.22 g) のアセトニトリル (50 ml) 溶液に、2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン (2.3 g) と炭酸カリウム (4.4 g) を加え、混合物を一晩加熱還流した。混合物を冷却後、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物 (37) (0.15 g) および (38) (0.55 g) を得た。

(37) : 黄色油状、 $^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.01 (d, 3H), 1.59 (br s, 1H), 1.77-1.94 (m, 3H), 3.21 (t, 1H), 3.44-3.53 (m, 1H), 3.85-3.98 (m, 3H), 6.65 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

(38) : 黄色油状、 $^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  1.07 (d, 3H), 1.46-1.63 (m, 3H), 2.00-2.07 (m, 1H), 2.65 (t, 1H), 3.02 (t, 1H), 3.40-3.47 (m, 1H), 4.26-4.40 (m, 2H), 6.66 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.37 (s, 1H)

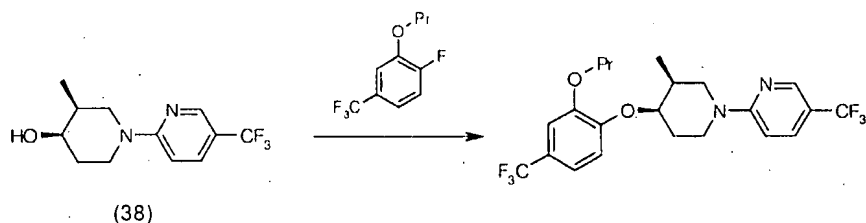
【0182】

工程 2

cis-3-Methyl-4-[2-propoxy-4-(trifluoromethyl)phenoxy]-1-[5-(trifluoromethyl)-2-pyridyl]piperidine の製造

【0183】

【化 38】



【0184】

化合物(38)(0.15g)のDMF(4ml)溶液に、60%水素化ナトリウム(0.023g)を室温で加えた。混合物を70℃に昇温して4-フルオロ-3-プロボキシベンゾトリフルオライド(0.14g)を加え、100℃で一晩加熱した。混合物を室温まで冷やした後に、水に注いで、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、ろ過し、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィーにより精製し、標記化合物(0.18g)を得た。

$n_D^{22.8} 1.5000$   $^1\text{H}$  NMR(CDC13)  $\delta$  1.05(t, 3H), 1.12(d, 3H), 1.71-1.92(m, 4H), 2.02-2.08(m, 2H), 3.40(t-like, 1H), 3.51(t-like, 1H), 3.95-4.05(m, 3H), 4.55(brs-like, 1H), 6.67(d, 1H), 7.00(d, 1H), 7.08(d, 1H), 7.16(d, 1H), 7.61(dd, 1H), 8.39(s, 1H)

【0185】

上記実施例を含め本発明化合物の具体例を第1表～第8表に記載する。本発明の権利範囲はこれら実施例および具体例に限定されるものではない。

表中の略記号は以下の意味を示す。

vis; 粘稠物

amor; アモルファス

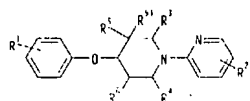
Me; メチル、Et; エチル、Pr; プロピル、Bu; ブチル、Hex; ヘキシル、Pen; ペンチル、i; イソ、n; ノルマル、t; ターシャリー、c; シクロ

Ac; アセチル

【0186】

【表 1】

表1



| 化合物<br>番号 | R <sup>1</sup>                              | R <sup>2</sup>    | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>6</sup> | 物理定数<br>[ ] : 熔点 °C        | 備考 |
|-----------|---|-------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------------------|----|
| 1-1       | 4-OH  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>22.2</sub> -1.5499 |    |
| 1-2       | 3-OH  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-3       | 2-OH  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-4       | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | vis                        |    |
| 1-5       | 4-F   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-6       | 3-F   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-7       | 2-F   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-8       | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [72-74]                    |    |
| 1-9       | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>23.1</sub> -1.5071 |    |
| 1-10      | 4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [90-92]                    |    |
| 1-11      | 3-Cl  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-12      | 2-Cl  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-13      | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>21.8</sub> -1.5210 |    |
| 1-14      | 3-Cl-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-15      | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                     | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>21.9</sub> -1.5275 |    |
| 1-16      | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [65-66]                    |    |
| 1-17      | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl                | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [71-73]                    |    |
| 1-18      | 2-Cl-6-O <sup>18</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [70-72]                    |    |
| 1-19      | 4-Br  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [87-90]                    |    |
| 1-20      | 3-Br  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-21      | 2-Br  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-22      | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>21.8</sub> -1.5320 |    |
| 1-23      | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                     | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | nD <sub>21.9</sub> -1.5365 |    |
| 1-24      | 4-I   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-25      | 3-I   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-26      | 2-I   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-27      | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | vis                        |    |
| 1-28      | 2-CF <sub>3</sub> -4-I                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-29      | 4-CN  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [157-161]                  |    |
| 1-30      | 3-CN  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-31      | 2-CN  | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-32      | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [101-102]                  |    |
| 1-33      | 2-CF <sub>3</sub> -4-CN                     | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-34      | 4-NO <sub>2</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [140-144]                  |    |
| 1-35      | 3-NO <sub>2</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-36      | 2-NO <sub>2</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              |                            |    |
| 1-37      | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [69-70]                    |    |
| 1-38      | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>        | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [96-97]                    |    |
| 1-39      | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>        | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | vis                        |    |
| 1-40      | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H              | [85-96]                    |    |

【表 2】

表1(続き)

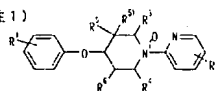
| 化合物<br>番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>         | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>51</sup> | R <sup>6</sup> | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C        | 備考 |
|-----------|--|------------------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------------------|----|
| 1-41      | 4-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-42      | 3-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-43      | 2-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-44      | 2,4-Me <sub>2</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.3</sub> -1.5410 |    |
| 1-45      | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-46      | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>24.4</sub> -1.5089 |    |
| 1-47      | 2,4,6-Me <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.2</sub> -1.5339 |    |
| 1-48      | 2-Me-4-F   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>24.3</sub> -1.5373 |    |
| 1-49      | 2-Me-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.9</sub> -1.5595 |    |
| 1-50      | 2-Me-4-Br  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-51      | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-52      | 2-Me-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-53      | 2-Me-4-Br  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-54      | 2-Et-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>24.6</sub> -1.5445 |    |
| 1-55      | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-56      | 2-Et-4-OCF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-57      | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>24.9</sub> -1.5394 |    |
| 1-58      | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-59      | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.5</sub> -1.5141 |    |
| 1-60      | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-61      | 2- <sup>i</sup> Pr-4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-62      | 2- <sup>i</sup> Pr-4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-63      | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>26.2</sub> -1.5110 |    |
| 1-64      | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Cl                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-65      | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Br                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-66      | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>23.3</sub> -1.5090 |    |
| 1-67      | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-68      | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-69      | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-Cl                  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-70      | 3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-71      | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.5</sub> -1.5069 |    |
| 1-72      | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> (Me)OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.6</sub> -1.5018 |    |
| 1-73      | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [68-71]                    |    |
| 1-74      | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-75      | 4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [48-50]                    |    |
| 1-76      | 3-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>23.1</sub> -1.5151 |    |
| 1-77      | 2-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-78      | 3,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-79      | 3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>21.6</sub> -1.4889 |    |
| 1-80      | 2,4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-81      | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-82      | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-83      | 4-CF <sub>3</sub>  | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>23.0</sub> -1.5150 |    |
| 1-84      | 4-CF <sub>3</sub>  | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>23.2</sub> -1.5089 |    |

【表 3】

表 1 (続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>       | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>51</sup>    | R <sup>6</sup> | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考          |
|-----------|--|----------------------|----------------|----------------|----------------|--------------------|----------------|---------------------|-------------|
| 1-85      | 4-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [86-88]             |             |
| 1-86      | 3-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-87      | 2-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-88      | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD22.8-1.5150       |             |
| 1-89      | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [50-53]             |             |
| 1-90      | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Cl                 | H              | H              | H              | H                  | H              | vis                 |             |
| 1-91      | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                 | H              | H              | H              | H                  | H              | [39-41]             |             |
| 1-92      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [55-65]             |             |
| 1-93      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | Me             | H              | H              | H                  | H              | vis                 |             |
| 1-94      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Me                 | H              | H              | H              | H                  | H              | nD21.4-1.5295       |             |
| 1-95      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | Me             | CO <sub>2</sub> Et | H              | vis                 |             |
| 1-96      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD22.2-1.4834       | N-oxide(注1) |
| 1-97      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | Me             | H                  | H              | nD22.8-1.5000       | cis         |
| 1-98      | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | Me             | H                  | H              | vis                 | trans       |
| 1-99      | 2-OPr-5-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD22.4-1.5068       |             |
| 1-100     | 2-OPr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD25.3-1.5060       |             |
| 1-101     | 2-OBu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [70-74]             |             |
| 1-102     | 2-OBu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [103-104]           |             |
| 1-103     | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [68-73]             |             |
| 1-104     | 2-OPen-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-105     | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD23.9-1.4969       |             |
| 1-106     | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-107     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-108     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [49-51]             |             |
| 1-109     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CO <sub>2</sub> Me | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-110     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CHF <sub>2</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-111     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CHO  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-112     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CN                 | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-113     | 2-CH <sub>2</sub> OPr-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-114     | 2-CH <sub>2</sub> OBu-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | vis                 |             |
| 1-115     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | [51-54]             |             |
| 1-116     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CN                 | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-117     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | vis                 |             |
| 1-118     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              | nD22.2-1.5121       |             |
| 1-119     | 2-CH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-120     | 2-CH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-121     | 2-CH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-122     | 2-CH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-123     | 2-CH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-124     | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-125     | 2-CH <sub>2</sub> CH(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-126     | 2-CH <sub>2</sub> CH(O)OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-127     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-128     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-129     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-130     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-131     | 2-CH <sub>2</sub> CH(Cl)Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |
| 1-132     | 2-CH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | H              | H              | H              | H                  | H              |                     |             |

注 1)



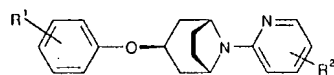
【表4】

表1(続き)

| 化合物<br>番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup> | R <sup>5</sup> | R <sup>51</sup> | R <sup>6</sup> | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C        | 備考 |
|-----------|---|------------------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|----------------------------|----|
| 1-133     | 4-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [30-32]                    |    |
| 1-134     | 3-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-135     | 2-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-136     | 4-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-137     | 3-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-138     | 2-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-139     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [82-84]                    |    |
| 1-140     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-141     | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>        | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-142     | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [75-77]                    |    |
| 1-143     | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-144     | 4-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [124-126]                  |    |
| 1-145     | 3-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-146     | 2-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-147     | 4-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [81-82]                    |    |
| 1-148     | 3-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-149     | 2-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-150     | 4-S(O)CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [83-85]                    |    |
| 1-151     | 3-S(O)CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-152     | 2-S(O)CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-153     | 4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [52-54]                    |    |
| 1-154     | 3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-155     | 2-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-156     | 4-OC(O)Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [154-156]                  |    |
| 1-157     | 3-OC(O)Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-158     | 2-OC(O)Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-159     | 4-OCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [109-110]                  |    |
| 1-160     | 3-OCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-161     | 2-OCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-162     | 4-OCH <sub>2</sub> (Naph-1-yl)                                | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [123-124]                  |    |
| 1-163     | 2-Propargyl-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-164     | 2-(OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [93-95]                    |    |
| 1-165     | 2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> | H              | H              | H              | H               | H              | [58-60]                    |    |
| 1-166     | 2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-167     | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [85-95]                    |    |
| 1-168     | 3-CF <sub>3</sub> -4-NH <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>21.6</sub> -1.5259 |    |
| 1-169     | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-170     | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> -6-Cl                    | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-171     | 2-NHMe-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              |                            |    |
| 1-172     | 2-NHEt-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-173     | 2-NH <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |
| 1-174     | 2-N <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>22.0</sub> -1.5121 |    |
| 1-175     | 2-N(Ac) <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [110-114]                  |    |
| 1-176     | 2-OC(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | nD <sub>23.9</sub> -1.5000 |    |
| 1-177     | 2-OC(O)SMe-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | [77-79]                    |    |
| 1-178     | 3-CF <sub>3</sub> -4-N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>       | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | amor                       |    |
| 1-179     | 2-C(O)Et-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      | H              | H              | H              | H               | H              | vis                        |    |

【表 5】

表2



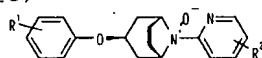
| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 2-1   | 4-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-2   | 3-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-3   | 2-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [90-94]             |    |
| 2-5   | 4-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-6   | 3-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-7   | 2-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-10  | 4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-11  | 3-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-12  | 2-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |    |
| 2-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-17  | 2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-18  | 4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-19  | 3-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-20  | 2-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [112-115]           |    |
| 2-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-23  | 4-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-24  | 3-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-25  | 2-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-27  | 4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-28  | 3-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-29  | 2-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [110-113]           |    |
| 2-31  | 4-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-32  | 3-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-33  | 2-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |    |
| 2-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 2-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

【表 6】

(表2続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考          |
|-------|---|------------------------|---------------------|-------------|
| 2-38  | 4-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-39  | 3-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-40  | 2-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | [121-123]           |             |
| 2-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      | [88-91]             |             |
| 2-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-47  | 2-Me-4-F  | 5-CF <sub>3</sub>      | [98-100]            |             |
| 2-48  | 2-Me-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-49  | 2-Et-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |             |
| 2-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      | [91-93]             |             |
| 2-55  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-57  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |             |
| 2-58  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |             |
| 2-59  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      | [89-91]             |             |
| 2-60  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      | [95-98]             | N-oxide(注2) |
| 2-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |             |
| 2-63  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-64  | 3-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-65  | 2-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |             |
| 2-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-70  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-71  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |             |
| 2-72  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |             |
| 2-73  | 4-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-74  | 3-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |
| 2-75  | 2-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |             |

注2)



【0192】

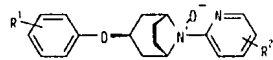


【表 7】

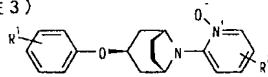
(表2続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>          | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考          |
|-------|---|-------------------------|---------------------|-------------|
| 2-76  | 2-OMe-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       | [85-90]             |             |
| 2-77  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-78  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-79  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Cl                    |                     |             |
| 2-80  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Br                    |                     |             |
| 2-81  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-82  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | [90-92]             |             |
| 2-83  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | [143-145]           | N-oxide(注3) |
| 2-84  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | [129-130]           | N-oxide(注2) |
| 2-85  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-Cl                    | [92-97]             |             |
| 2-86  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-Br                    | [50-52]             |             |
| 2-87  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-NO <sub>2</sub>       | [159-160]           |             |
| 2-88  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-NH <sub>2</sub>       | amor                |             |
| 2-89  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-Me                    | [97-98]             |             |
| 2-90  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-NHSO <sub>2</sub> Me  | amor                |             |
| 2-91  | 2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-92  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 6-CF <sub>3</sub>       | nd22.5-1.5090       |             |
| 2-93  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CN                    | [124-125]           |             |
| 2-94  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub> -6-CN | [132-134]           |             |
| 2-95  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-96  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | [113-115]           |             |
| 2-97  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-98  | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       | [126-129]           |             |
| 2-99  | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-100 | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-101 | 2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-102 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>       | [69-73]             |             |
| 2-103 | 2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-104 | 2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-105 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>       | [114-116]           |             |
| 2-106 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CO <sub>2</sub> Me    |                     |             |
| 2-107 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-108 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CHO                                  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-109 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CN                    |                     |             |
| 2-110 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Pr-4-CN                                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-111 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>       | [148-150]           |             |
| 2-112 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-113 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CN                    |                     |             |
| 2-114 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-115 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |             |
| 2-116 | 2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-117 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |
| 2-118 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |             |

注2)



注3)



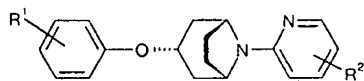
【表 8】

(表2続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考            |
|-------|--|-------------------|---------------------|---------------|
| 2-119 | 2-OCH <sub>2</sub> C(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-120 | 2-OCH <sub>2</sub> C(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-121 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-122 | 2-OCH <sub>2</sub> C(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-123 | 2-OCH <sub>2</sub> C(O)OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-124 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-125 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-126 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-127 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Cl)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-129 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-130 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-131 | 4-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-132 | 3-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-133 | 2-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-134 | 4-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-135 | 3-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-136 | 2-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-137 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-138 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-139 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-140 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> | [115-118]           |               |
| 2-141 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-142 | 2-Oallynyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |               |
| 2-143 | 2-Opropargyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-144 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-145 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> | [65-67]             | cisとtransの混合物 |
| 2-146 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> | [54-57]             |               |
| 2-147 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> | [96-98]             |               |
| 2-148 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 | cisとtransの混合物 |
| 2-149 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> | [93-97]             |               |
| 2-150 | 2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> | [112-115]           |               |
| 2-151 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> | [107-110]           |               |
| 2-152 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> | [121-124]           |               |
| 2-153 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub> | amor                |               |
| 2-154 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub> | [133-136]           |               |
| 2-155 | 2-SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | [140-143]           |               |
| 2-156 | 2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> | [150-153]           |               |
| 2-157 | 2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> | [165-168]           |               |
| 2-158 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub> | [87-91]             |               |
| 2-159 | 2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> | amor                |               |
| 2-160 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub> | [94-96]             |               |
| 2-161 | 2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |
| 2-162 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> | [165-168]           |               |
| 2-163 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> | [171-174]           |               |
| 2-164 | 2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub> | [181-183]           |               |
| 2-165 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub> | [87-90]             |               |
| 2-166 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> | [110-112]           |               |
| 2-167 | 2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub> | vis                 |               |

【表 9】

表3



| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                             | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|-------------------|---------------------|----|
| 3-1   | 4-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-2   | 3-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-3   | 2-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-5   | 4-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-6   | 3-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-7   | 2-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-10  | 4-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-11  | 3-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-12  | 2-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-17  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-18  | 4-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-19  | 3-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-20  | 2-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-23  | 4-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-24  | 3-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-25  | 2-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-27  | 4-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-28  | 3-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-29  | 2-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-31  | 4-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-32  | 3-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-33  | 2-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

表3(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|------------------------|---------------------|----|
| 3-38  | 4-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-39  | 3-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-40  | 2-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-47  | 2-Me-4-F  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-48  | 2-Me-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-49  | 2-Et-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-55  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-57  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-58  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-59  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-60  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |    |
| 3-63  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | [56-58]             |    |
| 3-64  | 3-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-65  | 2-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-70  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-71  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-72  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-73  | 4-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-74  | 3-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 3-75  | 2-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |

【表 1 1】

表 3 (続き)

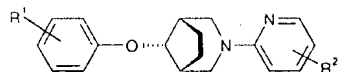
| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>          | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|-------------------------|---------------------|----|
| 3-76  | 2-OMe-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-77  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-78  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-79  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Cl                    |                     |    |
| 3-80  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                    |                     |    |
| 3-81  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-82  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       | [56-58]             |    |
| 3-83  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-84  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-85  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Cl                    |                     |    |
| 3-86  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                    |                     |    |
| 3-87  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NO <sub>2</sub>       |                     |    |
| 3-88  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NH <sub>2</sub>       |                     |    |
| 3-89  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Me                    |                     |    |
| 3-90  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NHSO <sub>2</sub> Me  |                     |    |
| 3-91  | 2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-92  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 6-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-93  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CN                    |                     |    |
| 3-94  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> -6-CN |                     |    |
| 3-95  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-96  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-97  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-98  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-99  | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-100 | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-101 | 2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-102 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-103 | 2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-104 | 2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-105 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-106 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CO <sub>2</sub> Me    |                     |    |
| 3-107 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-108 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHO                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-109 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CN                    |                     |    |
| 3-110 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-111 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-112 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-113 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CN                    |                     |    |
| 3-114 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-115 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-116 | 2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-117 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-118 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-119 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-120 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-121 | 2-OCH <sub>2</sub> C (Me <sub>2</sub> ) CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-122 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-123 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-124 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-125 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-126 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 3-127 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |

表3(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|-------------------|---------------------|----|
| 3-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Cl)Me-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-129 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-130 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-131 | 3-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-132 | 2-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-133 | 4-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-134 | 3-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-135 | 2-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-136 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-137 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-138 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-139 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-140 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-141 | 2-Oallynyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-142 | 2-Propargyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-143 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-144 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-145 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-146 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-147 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-148 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-149 | 2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-150 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-151 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-152 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-153 | 2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-154 | 2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-155 | 2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-156 | 2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-157 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-158 | 2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-159 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-160 | 2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-161 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-162 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-163 | 2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-164 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-165 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 3-166 | 2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

【表 1 3】

表 4



| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 4-1   | 4-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-2   | 3-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-3   | 2-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-5   | 4-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-6   | 3-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-7   | 2-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-10  | 4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-11  | 3-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-12  | 2-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-17  | 2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-18  | 4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-19  | 3-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-20  | 2-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-23  | 4-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-24  | 3-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-25  | 2-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-27  | 4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-28  | 3-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-29  | 2-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-31  | 4-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-32  | 3-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-33  | 2-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

表4(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|------------------------|---------------------|----|
| 4-38  | 4-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-39  | 3-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-40  | 2-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-47  | 2-Me-4-F   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-48  | 2-Me-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-49  | 2-Et-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-55  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-57  | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-58  | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-59  | 2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-60  | 2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-63  | 4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-64  | 3-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-65  | 2-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-70  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-71  | 4-CF <sub>3</sub>  | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-72  | 4-CF <sub>3</sub>  | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-73  | 4-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-74  | 3-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 4-75  | 2-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |



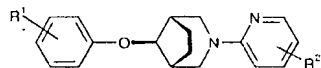
表4(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>          | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|-------------------------|---------------------|----|
| 4-76  | 2-OMe-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-77  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-78  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-79  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Cl                    |                     |    |
| 4-80  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                    |                     |    |
| 4-81  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-82  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       | [55-57]             |    |
| 4-83  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-84  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-85  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Cl                    |                     |    |
| 4-86  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                    |                     |    |
| 4-87  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NO <sub>2</sub>       |                     |    |
| 4-88  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NH <sub>2</sub>       |                     |    |
| 4-89  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Me                    |                     |    |
| 4-90  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-NHSO <sub>2</sub> Me  |                     |    |
| 4-91  | 2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-92  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 6-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-93  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CN                    |                     |    |
| 4-94  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> -6-CN |                     |    |
| 4-95  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-96  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-97  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-98  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-99  | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-100 | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-101 | 2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-102 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-103 | 2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-104 | 2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-105 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-106 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CO <sub>2</sub> Me    |                     |    |
| 4-107 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-108 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHO                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-109 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CN                    |                     |    |
| 4-110 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-111 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-112 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-113 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CN                    |                     |    |
| 4-114 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-115 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-116 | 2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-117 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-118 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-119 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-120 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-121 | 2-OCH <sub>2</sub> C (Me <sub>2</sub> ) CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-122 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-123 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-124 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-125 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-126 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 4-127 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |

表4(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 4-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-129 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-130 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-131 | 4-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-132 | 3-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-133 | 2-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-134 | 4-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-135 | 3-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-136 | 2-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-137 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Br-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-138 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-139 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-140 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl) -4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-141 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-142 | 2-Oallyenyl-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-143 | 2-Opropargyl-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-144 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-145 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-146 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-147 | 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-148 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-149 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-150 | 2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-151 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-152 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-153 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-154 | 2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-155 | 2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>        | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-156 | 2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-157 | 2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-158 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-159 | 2-N ( <sup>n</sup> Pr) 2-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-160 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-161 | 2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-162 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-163 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-164 | 2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) 2-4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-165 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-166 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 4-167 | 2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

表5



| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 5-1   | 4-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-2   | 3-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-3   | 2-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | amor                |    |
| 5-5   | 4-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-6   | 3-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-7   | 2-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-10  | 4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-11  | 3-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-12  | 2-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-14  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-15  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-16  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-17  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> 6-Cl               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-18  | 2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-19  | 4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-20  | 3-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-21  | 2-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-22  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [85-87]             |    |
| 5-23  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-24  | 4-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-25  | 3-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-26  | 2-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-27  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-28  | 2-CF <sub>3</sub> -4-I                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-29  | 4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-30  | 3-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-31  | 2-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-32  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [125-126]           |    |
| 5-33  | 2-CF <sub>3</sub> -4-CN                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-34  | 4-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-35  | 3-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-36  | 2-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-37  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-38  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> | [107-109]           |    |
| 5-39  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-40  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

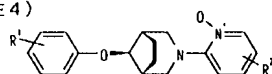
表5(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|--|------------------------|---------------------|----|
| 5-41  | 4-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-42  | 3-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-43  | 2-Me   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-44  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-45  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-46  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-47  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-48  | 2-Me-4-F   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-49  | 2-Me-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-50  | 2-Me-4-Br  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-51  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-52  | 2-Me-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-53  | 2-Me-4-Br  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-54  | 2-Et-4-Cl  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-55  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-56  | 2-Et-4-OCF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-57  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-58  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Br                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-59  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-60  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-61  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-Cl                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-62  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-Br                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-63  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-64  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Cl                               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-65  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-Br                               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-66  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-67  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-68  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-69  | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |    |
| 5-70  | 3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | nd22.5-1.5110       |    |
| 5-71  | 2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-72  | 2-CH <sub>2</sub> OCH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      | [56-57]             |    |
| 5-73  | 2-CH(Me)OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |    |
| 5-74  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-75  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>      | amor                |    |
| 5-76  | 4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-77  | 3-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-78  | 2-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-79  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-80  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-81  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-82  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-83  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-84  | 4-CF <sub>3</sub>  | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-85  | 4-CF <sub>3</sub>  | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 5-86  | 4-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-87  | 3-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-88  | 2-OMe  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 5-89  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |    |
| 5-90  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |    |
| 5-91  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-Cl                   |                     |    |

表5(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>       | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考          |
|-------|--|----------------------|---------------------|-------------|
| 5-92  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>  | 5-Br                 |                     |             |
| 5-93  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CH <sub>2</sub> F  | vis                 |             |
| 5-94  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-Me                 |                     |             |
| 5-95  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-96  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CN                 | [95-97]             |             |
| 5-97  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    | [48-50]             |             |
| 5-98  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 | N-oxide(注4) |
| 5-99  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CHF <sub>2</sub>   | vis                 |             |
| 5-100 | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CHO                | [98-100]            |             |
| 5-101 | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CH <sub>2</sub> OH | vis                 |             |
| 5-102 | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>    | [97-101]            |             |
| 5-103 | 3-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-104 | 2-(O <sup>n</sup> Pr-2,2-CI <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-105 | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    | [74-77]             |             |
| 5-106 | 2-OBn-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>    | ND22.3-1.5441       |             |
| 5-107 | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-108 | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-109 | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-110 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>    | [86-88]             |             |
| 5-111 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CN                 | [117-119]           |             |
| 5-112 | 2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-113 | 2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-114 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OAc-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-115 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )OAc-4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-116 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>    | [51-53]             |             |
| 5-117 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CO <sub>2</sub> Me | [136-138]           |             |
| 5-118 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-119 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CHO                                   | 5-CF <sub>3</sub>    | [106-109]           |             |
| 5-120 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CN                 | [87-89]             |             |
| 5-121 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CN                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | [109-112]           |             |
| 5-122 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>    |                     |             |
| 5-123 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-124 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-125 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CN                 | [90-92]             |             |
| 5-126 | 2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-127 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(OH)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(OMe)Me-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-129 | 2-OCH <sub>2</sub> C(OH)Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-130 | 2-OCH <sub>2</sub> C(OMe)Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-131 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me <sub>2</sub> )CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-132 | 2-OCH <sub>2</sub> C(O)OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-133 | 2-OCH <sub>2</sub> C(O)OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-134 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OAc-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-135 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub>    | [61-62]             |             |
| 5-136 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-137 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-138 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(CI)Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |
| 5-139 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CM <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>    | vis                 |             |

注4)



【表 20】

表5(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考               |
|-------|---|------------------------|---------------------|------------------|
| 5-140 | 4-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-141 | 3-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-142 | 2-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-143 | 4-OCF <sub>2</sub> Brr  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-144 | 3-OCF <sub>2</sub> Brr  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-145 | 2-OCF <sub>2</sub> Brr  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-146 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Brr-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-147 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |                  |
| 5-148 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-149 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | [47-51]             |                  |
| 5-150 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-151 | 4-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-152 | 3-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-153 | 2-CO <sub>2</sub> Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-154 | 4-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-155 | 3-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-156 | 2-SCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-157 | 4-S (O) CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-158 | 3-S (O) CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-159 | 2-S (O) CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-160 | 4-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-161 | 2-CSC <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | [159-161]           |                  |
| 5-162 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | [123-126]           |                  |
| 5-163 | 2-OSO <sub>2</sub> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |                  |
| 5-164 | 2-OSO <sub>2</sub> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub>      | [109-112]           |                  |
| 5-165 | 3-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-166 | 2-OSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-167 | 4-OC (O) Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-168 | 3-OC (O) Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-169 | 2-OC (O) Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-170 | 4-UCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-171 | 3-UCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-172 | 2-UCH <sub>2</sub> Ph   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-173 | 4-UCH <sub>2</sub> (Naph-1-yl)  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-174 | 2-UCH <sub>2</sub> (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub>      | [70-74]             |                  |
| 5-175 | 2-UCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 | cis & trans の混合物 |
| 5-176 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |                  |
| 5-177 | 2-Propionaryl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |                  |
| 5-178 | 2-[OCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub> ]-4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-179 | 2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-UCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>             | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |                  |
| 5-180 | 2,3,6-Cl <sub>3</sub> -4-UCH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-181 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | [157-159]           |                  |
| 5-182 | 2-UCH <sub>2</sub> C (=NOH) Me-4-CF <sub>3</sub> (anti)                   | 5-CF <sub>3</sub>      | [120-123]           |                  |
| 5-183 | 2-UCH <sub>2</sub> C (=NOH) Me-4-CF <sub>3</sub> (syn)                    | 5-CF <sub>3</sub>      | [55-59]             |                  |
| 5-184 | 2-OC=CC (=NOMe) Me-4-CF <sub>3</sub> (anti)                               | 5-CF <sub>3</sub>      | nn23.6-1.5100       |                  |
| 5-185 | 3-CF <sub>3</sub> -4-NH <sub>2</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-186 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>      | [110-113]           |                  |
| 5-187 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> -6-Cl                                | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-188 | 2-NHMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-189 | 2-NHMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-190 | 2-NH <sup>+</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      | [65-67]             |                  |
| 5-191 | 2-N (Me) Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | [64-67]             |                  |
| 5-192 | 2-N (Pr) L <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-193 | 2-NHAc-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      | [130-132]           |                  |
| 5-194 | 2-N (Ac) Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-195 | 2-OC (O) Me-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-196 | 2-OC (O) SMe-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-197 | 3-CF <sub>3</sub> -4-N (SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |                  |
| 5-198 | 2-OC (O) F <sub>1</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>      | [101-105]           |                  |
| 5-199 | 2-OC (O) Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | [104-106]           |                  |
| 5-200 | 2-OC (O) Bu-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>      | [127-130]           |                  |
| 5-201 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      | [179-182]           |                  |
| 5-202 | 2-IO <sup>+</sup> Pr-2,2-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub>      | vis                 |                  |

表6



| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                             | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|--|-------------------|---------------------|
| 6-1   | 4-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-2   | 3-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-3   | 2-OH                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> | amor                |
| 6-5   | 4-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-6   | 3-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-7   | 2-F  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-10  | 4-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-11  | 3-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-12  | 2-Cl                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-17  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-18  | 4-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-19  | 3-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-20  | 2-Br                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-23  | 4-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-24  | 3-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-25  | 2-I  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-27  | 4-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-28  | 3-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-29  | 2-CN                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-31  | 4-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-32  | 3-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-33  | 2-NO <sub>2</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |

表6(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|---|------------------------|---------------------|
| 6-38  | 4-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-39  | 3-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-40  | 2-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-47  | 2-Me-4-F  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-48  | 2-Me-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-49  | 2-Et-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-55  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-57  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-58  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-59  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-60  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-63  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-64  | 3-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-65  | 2-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-70  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-71  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-72  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-73  | 4-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-74  | 3-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 6-75  | 2-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |



表6(続き)

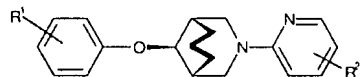
| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>          | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|---|-------------------------|---------------------|
| 6-76  | 2-OMe-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-77  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-78  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-79  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Cl                    |                     |
| 6-80  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Br                    |                     |
| 6-81  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-82  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       | vis                 |
| 6-83  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-84  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-85  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-Cl                    |                     |
| 6-86  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-Br                    |                     |
| 6-87  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-NO <sub>2</sub>       |                     |
| 6-88  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-NH <sub>2</sub>       |                     |
| 6-89  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-Me                    |                     |
| 6-90  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-NHSO <sub>2</sub> Me  |                     |
| 6-91  | 2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-92  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 6-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-93  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CN                    |                     |
| 6-94  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub> -6-CN |                     |
| 6-95  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-96  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-97  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-98  | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-99  | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-100 | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-101 | 2-OCH <sub>2</sub> CN-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-102 | 2-OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>       | [70-74]             |
| 6-103 | 2-OCH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-104 | 2-OCH <sub>2</sub> O <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-105 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-106 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CO <sub>2</sub> Me    |                     |
| 6-107 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHF <sub>2</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-108 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CHO                                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-109 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CN                    |                     |
| 6-110 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>t</sup> Pr-4-CN                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-111 | 2-OCH <sub>2</sub> <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-112 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-113 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CN                    |                     |
| 6-114 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OCH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-115 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OH-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-116 | 2-OCH <sub>2</sub> Ac-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-117 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-118 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-119 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-120 | 2-OCH <sub>2</sub> C (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-121 | 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-122 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-123 | 2-OCH <sub>2</sub> C (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-124 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2OAc-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-125 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-126 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NHAc-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |
| 6-127 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |

表6(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|--|-------------------|---------------------|
| 6-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(CI)Me-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-129 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-130 | 2-OCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-131 | 4-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-132 | 3-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-133 | 2-OCF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-134 | 4-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-135 | 3-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-136 | 2-OCF <sub>2</sub> Br  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-137 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-138 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-139 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-140 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-141 | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-142 | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-143 | 2-propargyl-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-144 | 2-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-145 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-146 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-147 | 2-OCH <sub>2</sub> C(Me)=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-148 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-149 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-150 | 2-OC(O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-151 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-152 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-153 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-154 | 2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-155 | 2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-156 | 2-OC(S)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-157 | 2-SC(O)NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-158 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-159 | 2-N( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-160 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-161 | 2-N(Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-162 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-163 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-164 | 2-N(SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-165 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-166 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 6-167 | 2-OP(O)(OEt)S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |

【表 2 5】

表7



| 化合物番号 | R <sub>1</sub>                            | R <sub>2</sub>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|---|-------------------|---------------------|
| 7-1   | 4-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-2   | 3-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-3   | 2-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> | [108-110]           |
| 7-5   | 4-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-6   | 3-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-7   | 2-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-10  | 4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-11  | 3-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-12  | 2-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-17  | 2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-18  | 4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-19  | 3-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-20  | 2-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-23  | 4-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-24  | 3-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-25  | 2-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-27  | 4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-28  | 3-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-29  | 2-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-31  | 4-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-32  | 3-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-33  | 2-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |

【0 2 1 1】

表7(続き)

| 化合物番号 | R 1   | R 2                    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|---|------------------------|---------------------|
| 7-39  | 3-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-40  | 2-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-47  | 2-Me-4-F  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-48  | 2-Me-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-49  | 2-Et-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-55  | 2-CH(OH) Et-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-57  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-58  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-59  | 2-CH <sub>2</sub> OCH(Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>         | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-60  | 2-CH <sub>2</sub> OCH(Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>         | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-63  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-64  | 3-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-65  | 2-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-70  | 2-CH(Cl) Et-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-71  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-72  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-73  | 4-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-74  | 3-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |
| 7-75  | 2-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |

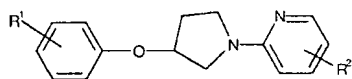
表7(続き)

| 化合物番号 | R 1                            | R 2        | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|--------------------------------|------------|---------------------|
| 7-76  | 2-OMe-4-CN                     | 5-CF3      |                     |
| 7-77  | 2-OMe-4-CF3                    | 5-CF3      |                     |
| 7-78  | 2-OEt-4-CF3                    | 5-CF3      |                     |
| 7-79  | 2-OEt-4-CF3                    | 5-Cl       |                     |
| 7-80  | 2-OEt-4-CF3                    | 5-Br       |                     |
| 7-81  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CN       | 5-CF3      |                     |
| 7-82  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-CF3      | vis                 |
| 7-83  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-Cl       |                     |
| 7-84  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-Br       |                     |
| 7-85  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-NO2      |                     |
| 7-86  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-NH2      |                     |
| 7-87  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-Me       |                     |
| 7-88  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-NHSO2Me  |                     |
| 7-89  | 2-O <sup>n</sup> Pr-5-CF3      | 5-CF3      |                     |
| 7-90  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 6-CF3      |                     |
| 7-91  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-CN       |                     |
| 7-92  | 2-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3      | 5-CF3-6-CN |                     |
| 7-93  | 2-Cl-6-O <sup>n</sup> Pr-4-CF3 | 5-CF3      |                     |
| 7-94  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF3      | 5-CF3      |                     |
| 7-95  | 2-O <sup>n</sup> Bu-4-CF3      | 5-CF3      |                     |
| 7-96  | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF3      | 5-CF3      |                     |
| 7-97  | 2-O <sup>n</sup> Hex-4-CF3     | 5-CF3      |                     |
| 7-98  | 2-O <sup>n</sup> Pen-4-CF3     | 5-CF3      |                     |
| 7-99  | 2-OCH2CN-4-CF3                 | 5-CF3      |                     |
| 7-100 | 2-OCH2OMe-4-CF3                | 5-CF3      | vis                 |
| 7-101 | 2-OCH2OEt-4-CF3                | 5-CF3      |                     |
| 7-102 | 2-OCH2O <sup>n</sup> Pr-4-CF3  | 5-CF3      |                     |
| 7-103 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CF3   | 5-CF3      | vis                 |
| 7-104 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CF3   | 5-CO2Me    |                     |
| 7-105 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CHF2  | 5-CF3      |                     |
| 7-106 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CHO   | 5-CF3      |                     |
| 7-107 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CF3   | 5-CN       |                     |
| 7-108 | 2-OCH2 <sup>c</sup> Pr-4-CN    | 5-CF3      |                     |
| 7-109 | 2-OCH2 <sup>i</sup> Bu-4-CF3   | 5-CF3      |                     |
| 7-110 | 2-O (CH2) 2OMe-4-CF3           | 5-CF3      |                     |
| 7-111 | 2-O (CH2) 2OMe-4-CF3           | 5-CN       |                     |
| 7-112 | 2-O (CH2) 2OCH2OMe-4-CF3       | 5-CF3      |                     |
| 7-113 | 2-O (CH2) 2OH-4-CF3            | 5-CF3      |                     |
| 7-114 | 2-OCH2Ac-4-CF3                 | 5-CF3      |                     |
| 7-115 | 2-OCH2CH (OH) Me-4-CF3         | 5-CF3      |                     |
| 7-116 | 2-OCH2CH (OMe) Me-4-CF3        | 5-CF3      |                     |
| 7-117 | 2-OCH2C (OH) Me2-4-CF3         | 5-CF3      |                     |
| 7-118 | 2-OCH2C (OMe) Me2-4-CF3        | 5-CF3      |                     |
| 7-119 | 2-OCH2C (Me2) CO2Me-4-CF3      | 5-CF3      |                     |
| 7-120 | 2-OCH2C (O) OMe-4-CF3          | 5-CF3      |                     |
| 7-121 | 2-OCH2C (O) OEt-4-CF3          | 5-CF3      |                     |
| 7-122 | 2-O (CH2) 2OAc-4-CF3           | 5-CF3      |                     |
| 7-123 | 2-O (CH2) 2NH2-4-CF3           | 5-CF3      |                     |
| 7-124 | 2-O (CH2) 2NHAc-4-CF3          | 5-CF3      |                     |
| 7-125 | 2-O (CH2) 2NMe2-4-CF3          | 5-CF3      |                     |

表7(続き)

| 化合物番号 | R <sub>1</sub>  | R <sub>2</sub>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C |
|-------|---|-------------------|---------------------|
| 7-126 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>                           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-127 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-128 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) OMe-4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-129 | 4-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-130 | 3-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-131 | 2-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-132 | 4-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-133 | 3-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-134 | 2-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-135 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-136 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-137 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-138 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-139 | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-140 | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-141 | 2-propargyl-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-142 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-143 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-144 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-145 | 2-OCH <sub>2</sub> CH (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-146 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-147 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-148 | 2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-149 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-150 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-151 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-152 | 2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-153 | 2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-154 | 2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-155 | 2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-156 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-157 | 2-N ( <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-158 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-159 | 2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-160 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-161 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-162 | 2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-163 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-164 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |
| 7-165 | 2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub> |                     |

表8



| 化合物番号 | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 8-1   | 4-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-2   | 3-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-3   | 2-OH                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-4   | 2-OH-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-5   | 4-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-6   | 3-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-7   | 2-F                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-8   | 2-F-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-9   | 3-CF <sub>3</sub> -4-F                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-10  | 4-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-11  | 3-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-12  | 2-Cl                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-13  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-14  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-15  | 2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-16  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub> -6-Cl              | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-17  | 2-Cl-6- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-18  | 4-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-19  | 3-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-20  | 2-Br                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-21  | 2-Br-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-22  | 3-CF <sub>3</sub> -4-Br                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-23  | 4-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-24  | 3-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-25  | 2-I                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-26  | 2-I-4-CF <sub>3</sub>                     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-27  | 4-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-28  | 3-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-29  | 2-CN                                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-30  | 2-CN-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-31  | 4-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-32  | 3-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-33  | 2-NO <sub>2</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-34  | 2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-35  | 2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-36  | 3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-37  | 2-CHO-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

表8(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>         | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|------------------------|---------------------|----|
| 8-38  | 4-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-39  | 3-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-40  | 2-Me  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-41  | 2, 4-Me <sub>2</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-42  | 2-Me-3-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-43  | 2-Me-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-44  | 2-Me-4-OCF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-45  | 2-Et-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-46  | 2, 4, 6-Me <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-47  | 2-Me-4-F  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-48  | 2-Me-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-49  | 2-Et-4-Cl   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-50  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-Cl                                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-51  | 2- <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-52  | 2- <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-53  | 2-CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-54  | 2-CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-55  | 2-CH(OH)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-56  | 2-CH <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-57  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-58  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-59  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-60  | 2-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-61  | 2-CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-62  | 2-allyl-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-63  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      | [109-112]           |    |
| 8-64  | 3-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-65  | 2-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-66  | 3, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-67  | 3, 5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-68  | 2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-69  | 2-CH <sub>2</sub> Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-70  | 2-CH(Cl)Et-4-CF <sub>3</sub>                            | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-71  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 3-Cl-5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-72  | 4-CF <sub>3</sub>                                       | 4-Me-6-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-73  | 4-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-74  | 3-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |
| 8-75  | 2-OMe   | 5-CF <sub>3</sub>      |                     |    |



【表 3 1】

表 8 (続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>          | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------------|---------------------|----|
| 8-76  | 2-OMe-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-77  | 2-OMe-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-78  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-79  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Cl                    |                     |    |
| 8-80  | 2-OEt-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Br                    |                     |    |
| 8-81  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CN  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-82  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       | [47-50]             |    |
| 8-83  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Cl                    |                     |    |
| 8-84  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Br                    |                     |    |
| 8-85  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-NO <sub>2</sub>       |                     |    |
| 8-86  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-NH <sub>2</sub>       |                     |    |
| 8-87  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-Me                    |                     |    |
| 8-88  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-NHSO <sub>2</sub> Me  |                     |    |
| 8-89  | 2-O <sup>i</sup> Pr-5-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-90  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 6-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-91  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CN                    |                     |    |
| 8-92  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub> -6-CN |                     |    |
| 8-93  | 2-Cl-5-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-94  | 2-O <sup>i</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-95  | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-96  | 2-O <sup>i</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-97  | 2-O <sup>i</sup> Hex-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-98  | 2-O <sup>i</sup> Pen-4-CF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-99  | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-100 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-101 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-102 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-103 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-104 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CO <sub>2</sub> Me    |                     |    |
| 8-105 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CHF <sub>2</sub>                                     | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-106 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CHO  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-107 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CN                    |                     |    |
| 8-108 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CN   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-109 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-110 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-111 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CN                    |                     |    |
| 8-112 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-113 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH-4-CF <sub>3</sub>                                  | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-114 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                                      | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-115 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OH) Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-116 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OMe) Me-4-CF <sub>3</sub>                              | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-117 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OH) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-118 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OMe) Me <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-119 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OMe) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-120 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (O) OMe-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-121 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (O) OEt-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-122 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-123 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-124 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NHAc-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-125 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-126 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (Cl) Me-4-CF <sub>3</sub>                               | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-127 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OMe) <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |
| 8-128 | 2-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (OMe) OMe-4-CF <sub>3</sub>                             | 5-CF <sub>3</sub>       |                     |    |

【0 2 1 7】

表8(続き)

| 化合物番号 | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>    | 物理定数<br>[ ] : 融点 °C | 備考 |
|-------|---|-------------------|---------------------|----|
| 8-129 | 4-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> | [35-38]             |    |
| 8-130 | 3-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-131 | 2-OCF <sub>3</sub>  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-132 | 4-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-133 | 3-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-134 | 2-OCF <sub>2</sub> Br   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-135 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Br-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-136 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2Cl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-137 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2F-4-CF <sub>3</sub>                   | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-138 | 2-OCH <sub>2</sub> (Ph-4-Cl)-4-CF <sub>3</sub>                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-139 | 2-Oallyl-4-CF <sub>3</sub>                                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-140 | 2-Oallylenyl-4-CF <sub>3</sub>                                | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-141 | 2-Propargyl-4-CF <sub>3</sub>                                 | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-142 | 2-O (CH <sub>2</sub> ) 2CH=CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-143 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHMe-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-144 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-145 | 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) =CH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-146 | 2-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl-4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-147 | 2-OAc-4-CF <sub>3</sub>                                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-148 | 2-OC (O) <sup>t</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-149 | 2-OSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-150 | 2-OSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                       | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-151 | 2-SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>           | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-152 | 2-OSO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu-4-CF <sub>3</sub>          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-153 | 2-OSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>        | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-154 | 2-OC (S) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-155 | 2-SC (O) NMe <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                  | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-156 | 2-NH <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>                          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-157 | 2-N ( <sup>n</sup> Pr) 2-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-158 | 2-NH <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                        | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-159 | 2-N (Me) <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                    | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-160 | 2-NHSO <sub>2</sub> Me-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-161 | 2-NHSO <sub>2</sub> Et-4-CF <sub>3</sub>                      | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-162 | 2-N (SO <sub>2</sub> <sup>n</sup> Bu) 2-4-CF <sub>3</sub>     | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-163 | 2-S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>                         | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-164 | 2-SCH <sub>2</sub> <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>          | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |
| 8-165 | 2-OP (O) (OEt) S <sup>n</sup> Pr-4-CF <sub>3</sub>            | 5-CF <sub>3</sub> |                     |    |

## 【0218】

## NMR データ

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)

化合物番号 1-169

δ 1.85-1.95 (m, 2H), 2.05-2.24 (m, 2H), 3.57-3.65 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 4H), 4.62-4.69 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.86 (d, 1H), 6.96 (a set of s and d, 2H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-80

δ 1.98-2.05 (m, 4H), 3.69-3.78 (m, 2H), 3.86-3.

9.4 (m, 2H), 4.82-4.86 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-143

$\delta$  1.89-2.06 (m, 4H), 3.61-3.70 (m, 2H), 3.91-4.00 (m, 2H), 4.63-4.67 (m, 1H), 5.42 (d, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.85 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-163

$\delta$  1.86-2.09 (m, 4H), 2.53 (t, 1H), 3.57-3.66 (m, 2H), 3.94-4.03 (m, 2H), 4.60-4.67 (m, 1H), 4.77 (d, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号 1-172

$\delta$  1.29 (t, 3H), 1.83-1.94 (m, 2H), 2.04-2.14 (m, 2H), 3.15-3.24 (m, 2H), 3.53-3.62 (m, 2H), 3.95-4.01 (m, 2H), 4.23 (br s, 1H), 4.61-4.67 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0219】

化合物番号 1-69

$\delta$  1.88-2.09 (m, 4H), 3.41 (s, 3H), 3.66-3.74 (m, 2H), 3.84-3.93 (m, 2H), 4.66 (s, 2H), 4.68-4.75 (m, 3H), 6.68 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-173

$\delta$  1.00 (t, 3H), 1.67 (q, 2H), 1.86-1.93 (m, 2H), 2.06-2.12 (m, 2H), 3.07-3.15 (m, 2H), 3.55-3.63 (m, 2H), 3.93-4.01 (m, 2H), 4.32 (br s, 1H), 4.64-4.66 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.77-6.90 (m, 3H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-140

$\delta$  1.87-2.06 (m, 4H), 3.60-3.68 (m, 2H), 3.84 (t, 2H), 3.86-3.99 (m, 2H), 4.30 (t, 2H), 4.63-4.68 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 1-74

$\delta$  1.91-2.08 (m, 4H), 3.42 (d, 2H), 3.74-3.86 (m, 4H), 4.69-4.71 (m, 1H), 5.04-5.10 (m, 2H), 5.91-6.00 (m, 1H), 6.68 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.64 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 1-67

$\delta$  0.97 (t, 3H), 1.74-1.95 (m, 4H), 2.04-2.14 (m, 3H), 3.66-3.73 (m, 2H), 3.85-3.94 (m, 2H), 4.71-4.74 (m, 1H), 4.93-4.96 (m, 1H), 6.69 (d, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0220】

化合物番号 2-57

$\delta$  2.00-2.31 (m, 8H), 3.44 (s, 3H), 4.58-4.64 (m,

3 H), 4.70 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-58

$\delta$  1.25 (t, 3H), 2.00-2.29 (m, 8H), 3.68 (q, 2H), 4.58-4.64 (m, 3H), 4.71 (s, 2H), 4.84 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号 2-78

$\delta$  1.46 (t, 3H), 2.00-2.21 (m, 6H), 2.44-2.46 (m, 2H), 4.10 (q, 2H), 4.55 (br s, 2H), 4.61 (br s, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-141

$\delta$  2.01-2.31 (m, 6H), 2.40-2.47 (m, 2H), 4.56-4.63 (m, 5H), 5.32 (d, 1H), 5.46 (d, 1H), 6.01-6.14 (m, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 3-62

$\delta$  1.78-1.93 (m, 4H), 2.14-2.19 (m, 4H), 3.28 (d, 2H), 4.69 (br s, 2H), 4.83-4.90 (m, 1H), 4.95-5.02 (m, 2H), 5.77-5.91 (m, 1H), 6.59 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 8.43 (s, 1H)

【0221】

化合物番号 2-148

$\delta$  2.00-2.23 (m, 6H), 2.35-2.44 (m, 2H), 4.56-4.61 (m, 4H), 4.82 (q, 1H), 6.06-6.64 (m, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-144

$\delta$  1.99-2.20 (m, 6H), 2.40-2.47 (m, 2H), 2.57-2.64 (m, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.55-4.60 (m, 3H), 5.14 (dd, 2H), 5.86-5.99 (m, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-115

$\delta$  2.00-2.30 (m, 7H), 2.35-2.44 (m, 2H), 3.97-4.03 (m, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.52-4.65 (br s, plus t, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号 2-153

$\delta$  1.05 (t, 3H), 1.76-1.84 (m, 2H), 2.03 (d, 2H), 2.17-2.20 (m, 2H), 2.36-2.40 (m, 4H), 3.36 (t, 2H), 4.61 (br s, 2H), 4.72 (t, 1H), 6.58 (d, 1H), 6.92 (d, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物番号 2-112

$\delta$  2.00-2.21 (m, 6H), 2.39-2.47 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.79 (t, 2H), 4.16 (t, 2H), 4.56 (br s, 2H), 4

. 62 (b r s, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0222】

化合物番号2-161

δ 0.89 (t, 3H), 1.47-1.63 (m, 2H), 2.07-2.11 (m, 4H), 2.19-2.27 (m, 2H), 2.38-2.45 (m, 2H), 2.80 (s, 3H), 3.08 (t, 2H), 4.56 (b r s, 2H), 4.60 (t, 1H), 6.56 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号2-143

δ 2.00-2.24 (m, 6H), 2.38-2.45 (m, 2H), 2.54-2.56 (m, 1H), 4.56-4.63 (b r s plus t, 3H), 4.77 (d, 2H), 6.56 (d, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号2-138

δ 2.05-2.26 (m, 6H), 2.41-2.48 (m, 2H), 3.87 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 4.61-4.64 (b r s plus t, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物番号2-101

δ 2.11-2.40 (m, 8H), 4.58 (b r s, 2H), 4.65 (t, 1H), 4.86 (s, 2H), 6.57 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H)

化合物番号5-175

δ 1.57-1.64 (m, 2H), 1.75 (d, 3H), 2.03-2.06 (m, 2H), 2.58 (b r s, 2H), 3.08 (d, 2H), 4.18 (dd, 2H), 4.51 (d, 2H), 4.62-4.67 (m, 1H), 5.66-5.90 (m, 2H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

【0223】

化合物番号5-89

δ 1.57-1.69 (m, 2H), 2.03-2.07 (m, 2H), 2.59 (b r s, 2H), 3.10 (d, 2H), 3.89 (s, 3H), 4.18 (d, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号5-90

δ 1.45 (t, 3H), 1.57-1.68 (m, 2H), 2.03-2.07 (m, 2H), 2.58 (b r s, 2H), 3.08 (d, 2H), 4.06-4.20 (m, 4H), 4.62 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号5-176

δ 1.55-1.63 (m, 2H), 2.02-2.04 (m, 2H), 2.55-2.62 (m, 4H), 3.08 (d, 2H), 4.07 (t, 2H), 4.15 (dd, 2H), 4.63 (s, 1H), 5.16 (dd, 2H), 5.84-5.97 (m, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物番号5-139

δ 1.53-1.63 (m, 2H), 1.76 (d, 6H), 2.02-2.07 (m, 2H), 2.58 (b r s, 2H), 3.08 (d, 2H), 4.16 (dd, 2H),

4. 57 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 5. 46 (t, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-123

$\delta$  1. 60-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 09 (m, 2H), 2. 29 (br s, 1H), 2. 60 (br s, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 94 (br s, 2H), 4. 08-4. 22 (m, 4H), 4. 62 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 19 (s, 1H), 7. 20-7. 30 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0224】

化合物番号5-147

$\delta$  1. 58-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 06 (m, 2H), 2. 58 (br s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 84 (t, 2H), 4. 16-4. 30 (m, 4H), 4. 67 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 24-7. 26 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物番号5-124

$\delta$  1. 57-1. 69 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 57 (br s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 43 (s, 3H), 3. 77 (t, 2H), 4. 13-4. 20 (m, 4H), 4. 65 (s, 1H), 6. 60 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 17-7. 25 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-132

$\delta$  1. 57-1. 66 (m, 2H), 2. 00-2. 06 (m, 2H), 2. 59 (br s, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 79 (s, 3H), 4. 12-4. 22 (m, 2H), 4. 65-4. 69 (m, 3H), 6. 60 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 21-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物5-134

$\delta$  1. 58-1. 64 (m, 2H), 1. 95-2. 13 (m, 2H), 2. 06 (s, 3H), 2. 58 (br s, 2H), 3. 09 (d, 2H), 4. 16-4. 25 (m, 4H), 4. 44 (t, 2H), 4. 63 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 16 (s, 1H), 7. 22-7. 29 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物番号5-133

$\delta$  1. 31 (t, 3H), 1. 59-1. 65 (m, 2H), 2. 04-2. 07 (m, 2H), 2. 60 (br s, 2H), 3. 10 (d, 2H), 4. 14-4. 30 (m, 4H), 4. 68 (s, 3H), 6. 61 (d, 1H), 7. 05 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 25-7. 28 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0225】

化合物番号5-163

$\delta$  1. 15 (t, 3H), 1. 62-1. 69 (m, 2H), 1. 99-2. 12 (m, 4H), 2. 64 (br s, 2H), 3. 14 (d, 2H), 3. 32 (t, 2H), 4. 23 (dd, 2H), 4. 64 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 14 (d, 1H), 7. 53 (d, 1H), 7. 54 (s, 1H), 7. 64 (dd, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物5-126

$\delta$  1. 63-1. 68 (m, 2H), 1. 93-2. 04 (m, 2H), 2. 35 (s, 3H), 2. 61 (br s, 2H), 3. 12 (d, 2H), 4. 21 (dd, 2H),

4. 58 (s, 2H), 4. 66 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 05 (s-like, 2H), 7. 26 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5-127

δ 1. 27 (d, 3H), 1. 59-1. 67 (m, 2H), 2. 00-2. 04 (m, 2H), 2. 61 (brs, 3H), 3. 12 (d, 2H), 3. 81 (t, 1H), 4. 04 (dd, 1H), 4. 08-4. 22 (m, 3H), 4. 62 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 03 (d, 1H), 7. 12 (s, 1H), 7. 20 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5-128

δ 1. 28 (d, 3H), 1. 57-1. 64 (m, 2H), 2. 01-2. 04 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 46 (s, 3H), 3. 69-3. 80 (m, 1H), 3. 91-4. 04 (m, 1H), 4. 18 (brd, 2H), 4. 64 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 12 (s, 1H), 7. 16 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

【0226】

化合物5-129

δ 1. 28 (s, 6H), 1. 56-1. 67 (m, 2H), 1. 99-2. 04 (m, 2H), 2. 46 (s, 1H), 2. 60 (brs, 2H), 3. 11 (d, 2H), 3. 85 (s, 2H), 4. 20 (dd, 2H), 4. 62 (s, 1H), 6. 62 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 14 (s, 1H), 7. 18 (s-like, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5-130

δ 1. 33 (s, 6H), 1. 58-1. 64 (m, 2H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 10 (d, 2H), 3. 31 (s, 3H), 3. 87 (s, 2H), 4. 18 (dd, 2H), 4. 65 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 18 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5-114

δ 1. 37 (d, 3H), 1. 57-1. 64 (m, 2H), 1. 77-1. 90 (m, 1H), 2. 03-2. 05 (m, 2H), 2. 04 (s, 3H), 2. 57 (brs, 2H), 3. 09 (d, 2H), 3. 57 (t, 1H), 4. 03-4. 20 (m, 2H), 4. 62 (s, 1H), 5. 25-5. 35 (m, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 02 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 22 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 39 (s, 1H)

化合物5-138

δ 1. 58-1. 70 (m plus d, 5H), 2. 02-2. 05 (m, 2H), 2. 58 (brs, 2H), 3. 10 (d, 2H), 4. 03-4. 21 (m, 4H), 4. 28-4. 38 (m, 1H), 4. 66 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 04 (d, 1H), 7. 13 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

【0227】

化合物5-98

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 80-1. 92 (m, 2H), 2. 01-2. 04 (m, 4H), 2. 57 (brs, 2H), 2. 93 (d, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 18 (dd, 2H), 4. 57 (s, 1H), 6. 85 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 35 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5-202

$\delta$  1.41 (t, 1H), 1.59–1.66 (m, 2H), 1.77 (t, 1H), 2.05–2.22 (m, 3H), 2.60 (br s, 2H), 3.11 (dd, 2H), 4.05 (t, 1H), 4.19 (dd, 2H), 4.29 (dd, 1H), 4.66 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.23 (d-like, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 6-82

$\delta$  0.92 (t, 3H), 1.42–1.47 (m, 1H), 1.57–1.80 (m, 5H), 1.98–2.04 (m, 2H), 2.35 (br s, 2H), 3.55 (dd, 2H), 3.93 (t, 2H), 4.08 (d, 2H), 4.48 (t, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.62 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 7-103

$\delta$  0.35–0.40 (m, 2H), 0.61–0.67 (m, 2H), 1.24–1.36 (m, 1H), 1.45–1.51 (m, 1H), 1.57–1.63 (m, 2H), 1.67–1.88 (m, 1H), 2.18–2.31 (m, 4H), 3.25 (d, 2H), 3.91 (d, 2H), 4.46 (d, 2H), 4.62 (s, 1H), 6.66 (d, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2-130

$\delta$  1.31 (d, 3H), 2.00–2.22 (m, 6H), 2.40–2.50 (m, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.72–3.81 (m, 1H), 3.88–3.93 (m, 1H), 4.01–4.06 (m, 1H), 4.56–4.61 (m+br s, 3H), 6.56 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物 1-98

$\delta$  1.05 (t, 3H), 1.13 (d, 3H), 1.71–1.91 (m, 4H), 2.05–2.15 (m, 2H), 3.00 (dd, 1H), 3.22–3.30 (m, 1H), 3.93 (t, 2H), 4.10–4.24 (m, 2H), 6.67 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 5-118

$\delta$  0.36 (q, 2H), 0.63 (q, 2H), 1.19–1.31 (m, 1H), 1.55–1.63 (m, 2H), 2.07 (br t, 2H), 2.57 (br s, 2H), 3.07 (d, 2H), 3.87 (d, 2H), 4.17 (dd, 2H), 4.63 (s, 1H), 6.59 (d+q, 2H), 6.99–7.03 (m, 3H), 7.61 (dd, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物 6-4

$\delta$  1.40–1.56 (m, 1H), 1.75–1.86 (m, 3H), 1.91–2.05 (m, 2H), 2.61 (br s, 2H), 3.40 (dd, 2H), 4.16 (d, 2H), 4.56 (t, 1H), 5.81 (s, 1H), 6.62 (d, 1H), 6.91 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.63 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H)

化合物 2-90

$\delta$  1.08 (t, 3H), 1.81–1.93 (m, 2H), 1.97–2.09 (m, 4H), 2.16–2.24 (m, 2H), 2.40–2.46 (m, 2H), 2.98 (s, 3H), 3.97 (t, 2H), 4.48 (br s, 2H), 4.59 (t, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.77 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 8.07 (s, 1H)

化合物 2-167

$\delta$  0.98 (t, 3H), 1.42 (t, 3H), 1.67–1.75 (m, 2H), 2



. 01—2. 23 (m, 6H), 2. 42 (d, 2H), 2. 87—2. 97 (m, 2H), 4. 28—4. 35 (m, 2H), 4. 57 (b r s, 2H), 4. 62 (t, 1H), 6. 56 (d, 1H), 6. 84 (d, 1H), 7. 39 (d, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 7. 70 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

【0228】

化合物1—95

δ 1. 02—1. 16 (m, 8H), 1. 26 (s, 3H), 1. 79—1. 94 (m, 4H), 3. 30 (m, 1H), 3. 80 (d, 1H), 3. 90—3. 99 (m, 2H), 4. 08 (q, 2H), 4. 13—4. 38 (m, 2H), 4. 77 (b r s, 1H), 6. 71 (d, 1H), 7. 06 (s, 1H), 7. 09 (d, 1H), 7. 16 (d, 1H), 7. 60 (dd, 1H), 8. 37 (s, 1H)

化合物5—93

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 63—1. 69 (m, 2H), 1. 74—1. 88 (m, 2H), 2. 00—2. 02 (m, 2H), 2. 55 (b r s, 2H), 3. 01 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 07—4. 16 (m, 2H), 4. 38 (s, 2H), 4. 59 (s, 1H), 6. 59 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 10 (s, 1H), 7. 13 (d, 1H), 7. 50 (dd, 1H), 8. 12 (s, 1H)

化合物2—81

δ 1. 09 (t, 3H), 1. 84—2. 21 (m, 8H), 2. 40—2. 43 (m, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 56—4. 62 (b r m, 3H), 6. 56 (d, 1H), 6. 73 (d, 1H), 7. 08 (s, 1H), 7. 23 (m, 1H), 7. 62 (dd, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物2—67

δ 2. 00—2. 21 (m, 4H), 2. 28—2. 35 (m, 4H), 4. 59 (b r s, 2H), 4. 66 (t, 1H), 6. 58 (d, 1H), 6. 88 (d, 1H), 7. 63 (dd, 1H), 7. 74 (d, 1H), 7. 86 (s, 1H), 8. 41 (s, 1H)

化合物5—99

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 58—1. 63 (m, 2H), 1. 65—1. 89 (m, 2H), 2. 02—2. 04 (m, 2H), 2. 57 (b r s, 2H), 3. 06 (d, 2H), 4. 00 (t, 2H), 4. 16 (d, 2H), 4. 62 (s, 1H), 6. 57 (t, 1H), 6. 63 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 60 (dd, 1H), 8. 24 (s, 1H)

【0229】

化合物5—103

δ 1. 04 (t, 3H), 1. 57—1. 64 (m, 2H), 1. 77—1. 88 (m, 2H), 1. 96—2. 04 (m, 2H), 2. 58 (b r s, 2H), 3. 13 (d, 2H), 3. 91 (t, 2H), 4. 17 (d, 2H), 4. 52 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 6. 63 (d, 1H), 6. 75 (s—like, 2H), 7. 63 (dd, 1H), 8. 40 (s, 1H)

化合物5—101

δ 1. 06 (t, 3H), 1. 47—1. 67 (m, 3H), 1. 79—1. 91 (m, 2H), 2. 01—2. 04 (m, 2H), 2. 56 (b r s, 2H), 3. 03 (d, 2H), 3. 97 (t, 2H), 4. 09 (dd, 2H), 4. 57 (b r s, 2H), 4. 60 (s, 1H), 6. 61 (d, 1H), 7. 01 (d, 1H), 7. 11 (s, 1H), 7. 17 (d, 1H), 7. 52 (dd, 1H), 8. 14 (s, 1H)

化合物5—4

δ 1. 69 (m, 2H), 1. 97 (m, 2H), 2. 65 (b s, 2H), 3. 14 (d, 2H), 4. 24 (dd, 2H), 4. 65 (s, 1H), 5. 65 (s, 1H), 6. 63 (d, 1H), 6. 99 (d, 1H), 7. 14 (d, 1H), 7. 20 (s,

1 H), 7.65 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-177

$\delta$  1.62 (m, 2H), 2.04 (m, 2H), 2.53 (s, 1H), 2.60 (bs, 2H), 3.10 (d, 2H), 4.19 (dd, 2H), 4.63 (s, 1H), 4.77 (s, 2H), 6.61 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.27 (m, 2H), 7.62 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-75

$\delta$  1.63 (m, 2H), 1.98 (m, 2H), 2.61 (bs, 2H), 3.15 (d, 2H), 3.37 (d, 1H), 3.68 (d, 1H), 4.20 (dd, 2H), 4.61 (s, 1H), 5.07 (d, 2H), 5.93 (m, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.41 (s, 1H)

【0230】

化合物5-69

$\delta$  1.65 (m, 2H), 1.94 (m, 2H), 2.61 (bs, 2H), 3.15 (d, 2H), 3.43 (s, 3H), 4.21 (dd, 2H), 4.63 (m, 3H), 4.77 (s, 2H), 6.62 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-131

$\delta$  1.35 (s, 6H), 1.58 (m, 2H), 2.02 (m, 2H), 2.55 (bs, 2H), 3.07 (d, 2H), 3.68 (s, 3H), 4.02 (s, 2H), 4.15 (dd, 2H), 4.58 (s, 1H), 6.61 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.10 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.39 (s, 1H)

化合物5-137

$\delta$  1.62 (m, 2H), 2.03 (m, 2H), 2.36 (s, 6H), 2.58 (bs, 2H), 2.77 (t, 2H), 3.09 (d, 2H), 4.14 (m, 4H), 4.63 (s, 1H), 6.60 (d, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-136

$\delta$  1.65 (m, 2H), 2.00 (m, 5H), 2.60 (bs, 2H), 3.11 (d, 2H), 3.67 (q, 2H), 4.10 (t, 2H), 4.21 (dd, 2H), 4.62 (s, 1H), 5.94 (bs, 1H), 6.62 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 8.40 (s, 1H)

化合物5-73

$\delta$  1.41 (d, 3H), 1.65 (d, 2H), 1.97 (m, 2H), 2.62 (bs, 1H), 3.15 (d, 2H), 3.37 (s, 3H), 4.20 (m, 2H), 4.62 (m, 3H), 5.08 (q, 1H), 6.63 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 8.40 (s, 1H)

【0231】

製剤実施例

(殺虫・殺ダニ剤)

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

【0232】

製剤実施例1

水和剤

本発明化合物

40部

|                 |       |
|-----------------|-------|
| 珪藻土             | 5 3 部 |
| 高級アルコール硫酸エステル   | 4 部   |
| アルキルナフタレンスルホン酸塩 | 3 部   |

以上を均一に混合して微細に粉砕して、有効成分 4 0 % の水和剤を得た。

#### 【0 2 3 3】

##### 製剤実施例 2 乳剤

|                      |       |
|----------------------|-------|
| 本発明化合物               | 3 0 部 |
| キシレン                 | 3 3 部 |
| ジメチルホルムアミド           | 3 0 部 |
| ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル | 7 部   |

以上を混合溶解して、有効成分 3 0 % の乳剤を得た。

#### 【0 2 3 4】

##### 製剤実施例 3 粉剤

|                      |       |
|----------------------|-------|
| 本発明化合物               | 1 0 部 |
| タルク                  | 8 9 部 |
| ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル | 1 部   |

以上を均一に混合して微細に粉砕して、有効成分 1 0 % の粉剤を得た。

#### 【0 2 3 5】

##### 製剤実施例 4 粒剤

|                      |       |
|----------------------|-------|
| 本発明化合物               | 5 部   |
| クレー                  | 7 3 部 |
| ベントナイト               | 2 0 部 |
| ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩 | 1 部   |
| リン酸ナトリウム             | 1 部   |

以上をよく粉砕混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分 5 % の粒剤を得た。

#### 【0 2 3 6】

##### 製剤実施例 5 懸濁剤

|                    |           |
|--------------------|-----------|
| 本発明化合物             | 1 0 部     |
| リグニンスルホン酸ナトリウム     | 4 部       |
| ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム | 1 部       |
| キサンタンガム            | 0 . 2 部   |
| 水                  | 8 4 . 8 部 |

以上を混合し、粒度が 1 ミクロン以下になるまで湿式粉砕し、有効成分 1 0 % の懸濁液を得た。

次に、本発明化合物が各種殺ダニ剤の有効成分として有用であることを試験例で示す。

#### 【0 2 3 7】

##### 試験例 1 ナミハダニに対する効力

3 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ~ 1 0 日を経過した第 1 本葉上に、有機リン剤抵抗性のナミハダニ雌成虫を 1 7 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 1 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 1 2 5 p p m になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 2 5 °C、湿度 6 5 % の恒温室内に置き、3 日後に殺成虫率を調査した。試験は 2 反復である。その結果以下の化合物が 1 0 0 % の殺虫率を示した。

1-8、1-9、1-10、1-13、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-22、1-23、1-27、1-29、1-44、1-45、1-46、1-47、1-48、1-49、1-54、1-57、1-59、1-63、1-66、1-67、1-69、1-71、1-72、1-73、1-74、1-75、1-76、1-

79、1-80、1-81、1-82、1-88、1-89、1-90、1-91、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-101、1-102、1-105、1-108、1-114、1-115、1-117、1-118、1-133、1-136、1-139、1-140、1-142、1-143、1-147、1-150、1-153、1-163、1-172、1-173、1-174、1-179、2-13、2-51、2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-62、2-77、2-78、2-81、2-82、2-83、2-84、2-85、2-86、2-89、2-93、2-95、2-96、2-97、2-98、2-100、2-102、2-105、2-111、2-112、2-115、2-130、2-138、2-141、2-143、2-144、2-145、2-147、2-148、2-150、2-151、2-152、2-155、2-157、2-159、2-160、2-161、2-165、2-166  
 5-22、5-32、5-38、5-69、5-70、5-72、5-73、5-75、5-89、5-90、5-96、5-97、5-98、5-99、5-100、5-102、5-104、5-105、5-106、5-110、5-111、5-114、5-116、5-118、5-120、5-121、5-124、5-125、5-126、5-127、5-128、5-129、5-130、5-134、5-138、5-139、5-147、5-149、5-161、5-162、5-163、5-164、5-174、5-175、5-176、5-177、5-182、5-183、5-184、5-190、5-191、5-198、5-199、5-200  
 7-82、7-100、7-103  
 8-63

# 【0238】

## 試験例2 ミカンハダニに対する効力

シャーレに入れたミカン葉上に、殺ダニ剤抵抗性のミカンハダニの雌成虫を10頭接種したのち、前記薬剤の実施例2に示された乳剤の処方に従い、化合物濃度が31ppmになるように水で希釈した薬液を回転散布塔にて散布した。温度25℃、湿度65%の恒温室内に置き、散布3日後に、成虫を除去し、この3日間に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか否かを11日目に調査した。その結果以下の化合物が100%の殺虫率を示した。

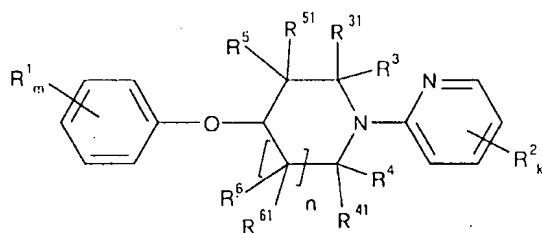
1-13、1-15、1-22、1-27、1-45、1-54、1-59、1-63、1-66、1-69、1-71、1-72、1-75、1-80、1-88、1-89、1-92、1-93、1-94、1-97、1-98、1-100、1-102、1-105、1-108、1-133、1-136、1-142、1-153、2-54、2-57、2-58、2-59、2-60、2-78、2-81、2-82、2-84、2-97、2-98、2-105、2-130、2-141、2-147、5-22、5-69、5-70、5-72、5-73、5-90、5-96、5-97、5-105、5-110、5-111、5-116、5-118、5-120、5-121、5-124、5-149、5-162、5-174、5-175、5-177、5-190、7-82、7-100、7-103

【書類名】 要約書

【課題】 本発明は、有害生物防除剤となりうる新規化合物を提供することを課題とする。

【解決手段】 一般式（１）

【化１】



〔１〕

【式中、R<sup>1</sup>は、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基等、R<sup>2</sup>は、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル基等、R<sup>3</sup>、R<sup>31</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>41</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>51</sup>、R<sup>6</sup>、およびR<sup>61</sup>はそれぞれ独立して、水素原子、またはC<sub>1-6</sub>アルキル基等、またはR<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>またはR<sup>5</sup>とR<sup>6</sup>とが一緒になって飽和環を形成し、全体として橋かけ環を形成してもよい。】

で表される化合物およびその塩の１種または２種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

【選択図】 なし

出願人履歴

0 0 0 0 0 4 3 0 7

19900822

新規登録

東京都千代田区大手町 2 丁目 2 番 1 号

日本曹達株式会社